

(19)世界知的所有権機関
国際事務局(43)国際公開日
2003年1月3日 (03.01.2003)

PCT

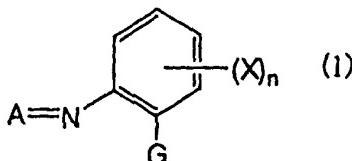
(10)国際公開番号
WO 03/000659 A1

- (51) 国際特許分類⁷: C07D 213/74, 239/42, 271/10, 277/42, 277/82, 279/06, 285/16, 285/12, 339/06, 327/04, 411/04, 411/10, 411/14, 413/04, 417/04, 417/10, 417/12, A01N 43/28, 43/30, 43/40, 43/50, 43/52, 43/54, 43/56, 43/64, 43/653, 43/76, 43/78, 43/82, 43/824, 43/824, 43/836, 43/86, 43/88, 43/90
- (21) 国際出願番号: PCT/JP02/06424
- (22) 国際出願日: 2002年6月26日 (26.06.2002)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:
特願2001-192285 2001年6月26日 (26.06.2001) JP
特願2001-193428 2001年6月26日 (26.06.2001) JP
特願2001-385120 2001年12月18日 (18.12.2001) JP
- (52) 発明者; および
(75) 発明者/出願人(米国についてのみ): 仁木 俊夫 (NIKU,Toshio) [JP/JP]; 〒274-8507 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社 物質科学研究所内 Chiba (JP). 水越 隆司 (MIZUKOSHI,Takashi) [JP/JP]; 〒274-8507 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社 物質科学研究所内 Chiba (JP). 高橋 寛明 (TAKAHASHI,Hiroaki) [JP/JP]; 〒274-8507 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社 物質科学研究所内 Chiba (JP). 佐藤 純 (SATOW,Jun) [JP/JP]; 〒274-8507 千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社 物質科学研究所内 Chiba (JP).

[続葉有]

(54) Title: HETEROCYCLOCLOIMINOPHENYL COMPOUNDS AND FUNGICIDES AND INSECTICIDES FOR AGRICULTURAL AND HORTICULTURAL USE

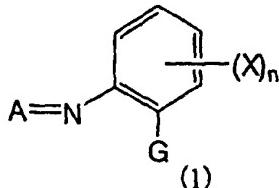
(54)発明の名称: ヘテロ環イミノフェニル化合物および農園芸用殺菌殺虫剤



(57) Abstract: Heterocyclocloiminophenyl compounds represented by the general formula (I) or agriculturally acceptable salts thereof; and pesticides, fungicides or insecticides for agricultural and horticultural use, containing the compounds or the salts; wherein A is an optionally substituted heterocycle; X is hydrogen or the like; and G is -CH₂COOMe, -N(Me)COOMe, or the like.

(57) 要約:

式(1):



WO 03/000659 A1

[式中、Aは置換されていてもよいヘテロ環を表し、Xは水素原子等を表し、Gは、-CH₂COOMe、-N(Me)COOMe等を表す。]で表されるヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩、それらを含む農薬、農園芸用殺菌剤または農園芸用殺虫剤。



井町 722 番地 1 日産化学工業株式会社 物質科学研究所内 Chiba (JP). 小倉 友幸 (OGURA,Tomoyuki) [JP/JP]; 〒101-0054 東京都 千代田区 神田錦町 3丁目 7 番地 1 日産化学工業株式会社内 Tokyo (JP). 山岸 和宏 (YAMAGISHI,Kazuhiro) [JP/JP]; 〒349-0218 埼玉県 南埼玉郡 白岡町大字白岡 1470 日産化学工業株式会社 生物科学研究所内 Saitama (JP). 鈴木 博之 (SUZUKI,Hiroyuki) [JP/JP]; 〒349-0218 埼玉県 南埼玉郡 白岡町大字白岡 1470 日産化学工業株式会社 生物科学研究所内 Saitama (JP). 早坂 史生 (HAYASAKA,Fumio) [JP/JP]; 〒349-0218 埼玉県 南埼玉郡 白岡町大字白岡 1470 日産化学工業株式会社 生物科学研究所内 Saitama (JP).

- (74) 代理人: 泉名 謙治, 外(SENMYO,Kenji et al.); 〒101-0042 東京都 千代田区 神田東松下町 38 番地 烏本鋼業ビル Tokyo (JP).
- (81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,

DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

- (84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ヨーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

明細書

ヘテロ環イミノフェニル化合物および農園芸用殺菌殺虫剤

技術分野

本発明は、新規なヘテロ環イミノフェニル化合物およびその塩、ならびに該ヘテロ環イミノフェニル化合物およびその塩から選ばれる一種以上を有効成分として含有する殺菌剤および殺虫剤に関する。

背景技術

ある種のイミノ化合物は、国際特許出願公開公報(WO-95/27693号公報)、ヨーロッパ特許出願公報(EP-254426号公報)で知られていて、農園芸用殺菌剤としての用途が開示されている。

しかし、本発明化合物のヘテロ環イミノフェニル化合物は、文献未記載の新規化合物である。

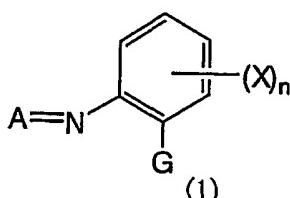
発明の開示

既存の農園芸用殺菌殺虫剤は、耐性菌や抵抗性害虫の増加または既存剤のスペクトラムの狭さ等からその効力や残効性の面で満足するべきものではない。そのため、低薬量で高い効力を有するとともに、より対象作物に対し安全性の高い殺菌剤および殺虫剤の開発が要望されている。

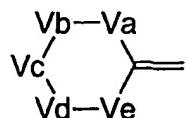
本発明者らは、このような状況に鑑み、優れた殺菌殺虫剤を見いだすべく種々検討した結果、新規なヘテロ環イミノフェニル化合物およびその塩が殺菌剤または殺虫剤として顕著な活性を有し、対象作物に対しても安全であることを見出し、本発明に至った。

すなわち、本発明は、下記の〔1〕ないし〔12〕に関するものである。

〔1〕 式(1) :



〔式中、 A は、



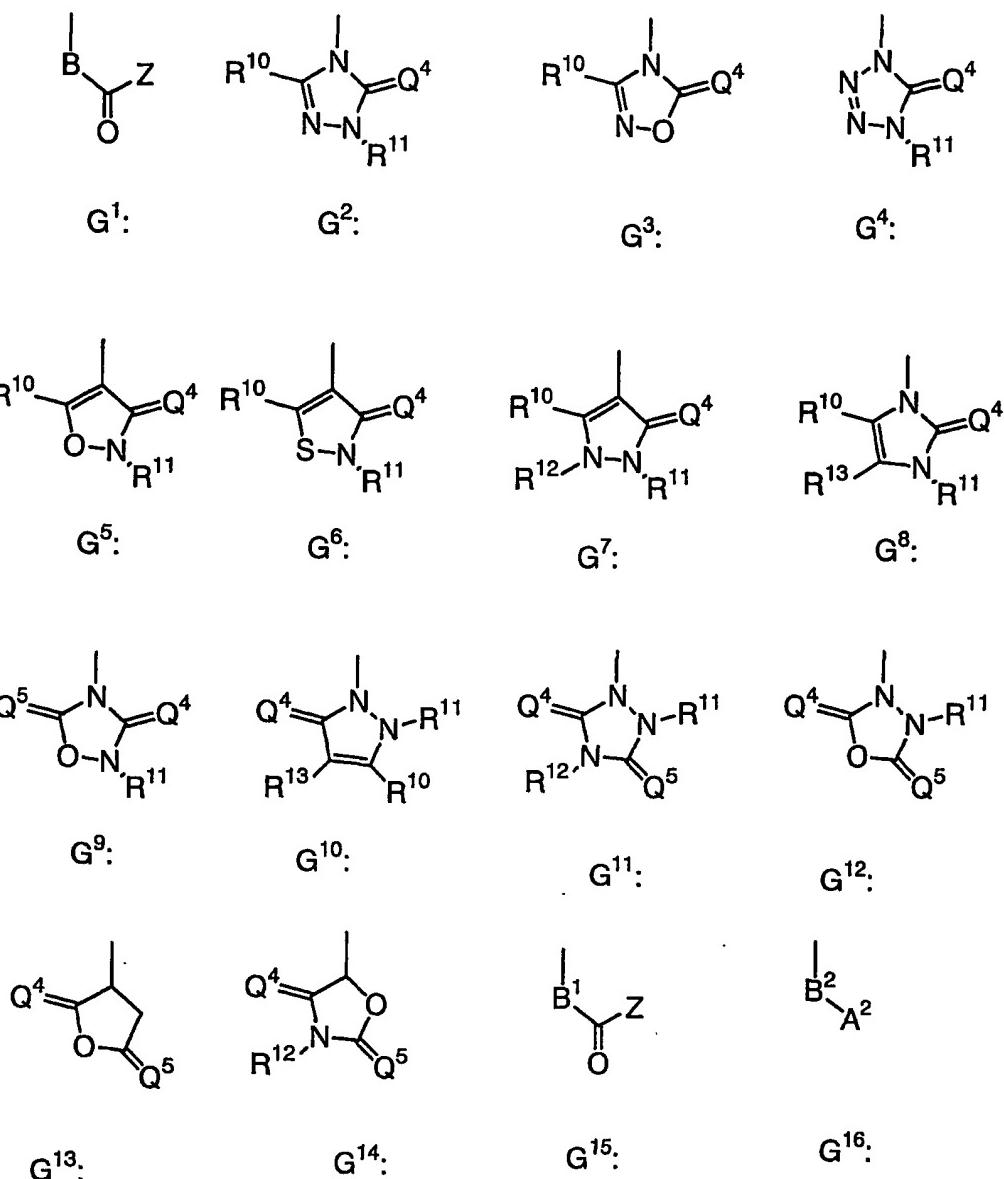
であり、V_a、V_b、V_cおよびV_dはそれぞれ独立に炭素原子、窒素原子、酸素原子または硫黄原子であり、V_eは炭素原子、窒素原子、酸素原子、硫黄原子または単結合であり（但し、V_a、V_b、V_c、V_dおよびV_eから選ばれる少なくとも1個は、窒素原子、酸素原子または硫黄原子である。）、

V_a—V_b、V_b—V_c、V_c—V_d、V_d—V_eの結合は、それぞれ単結合でも2重結合でもよく、

それぞれの原子上に水素原子またはYが結合していてもよく、

ただし、Aがキノロン環を表すときはキノロン環内の窒素原子は、イミノ結合のα位にあり、イミノ結合がピリミジン環、チアゾリン環またはチアゾリジン環の2位にあるときは、ピリミジン環の一方の窒素原子、チアゾリン環またはチアゾリジン環の窒素原子は置換基Yで置換されており、

Gは、G'からG¹⁶



から選ばれる基を表し、

Zは、-OR'、-SR'または-NR'R³であり、

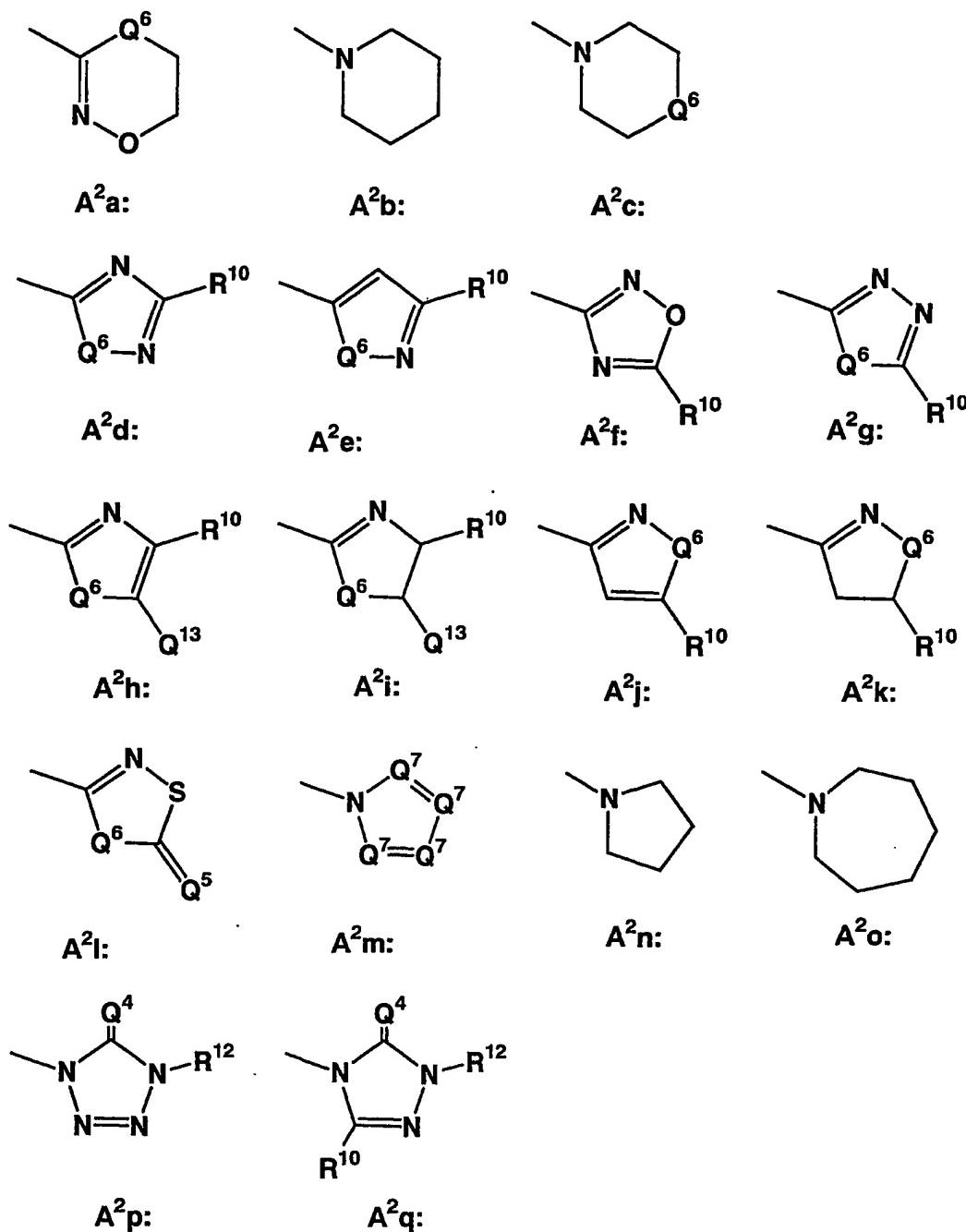
Bは、-CH₂-、-C(=CH-OR')-または-C(=N-OR')-であり、

B'は、-N(OR')-、-N(R⁵)-、-O-、-S-、-N(OR')-CH₂-、-N(R⁶)-CH₂-、-O-CH₂-、-S-CH₂-、-N(OR')-C(=CH-OR')-、-N(R⁶)-C(=CH-OR')-、-O-C(=C

$H - OR'$ -、 $-S - C (=CH - OR')$ -、 $-N (OR') - C (=N - OR')$ -、 $-N (R') - C (=N - OR')$ -、 $-O - C (=N - OR')$ -または $-S - C (=N - OR')$ -であり、

B' は、 $-CH,-CH(CN)$ -、 $-CH(C \equiv CH)$ -、 $-C (=CH - OR')$ -、 $-C (=N - OR')$ -、 $-CH(OR')$ -、 $-N(OR')$ -、 $-N(R')$ -、 $-O -$ 、 $-S -$ 、 $-N(OR') - CH$ -、 $-N(R') - CH$ -、 $-O - CH$ -または $-S - CH$ -、であり、

A' は、 R' で置換されていてもよいフェニル、 R' で置換されていてもよいピリジルまたは $A'a$ から $A'q$



から選ばれる基を表し、

Yは、Y'-D-(CH₂)_n-であるか（ただし、Yが2個以上の時は、同一または異なってもよい。）、Aの同一炭素原子上に置換した2個のYにより、該炭素原子とともに酸素原子、窒素原子または硫黄原子を各々1～3個含んでいて

もよい3～7員環またはC=Q'を形成するか、あるいはV_aとV_b、V_bとV_c、V_cとV_dまたはV_dとV_e上の2個の置換基Yどうしが一緒になって、V_aとV_b、V_bとV_c、V_cとV_dまたはV_dとV_eとともに炭素原子、窒素原子、酸素原子および硫黄原子から選ばれる同一または相異なった1種以上の原子を含み、Yで置換されていてもよい5または6員環を形成しており、

Dは、単結合、-NR⁶-、-C(=Q')-、-C(=Q')-C(=Q')-、-CR⁶=N-、-N=CR⁶-、-CR⁶=N-N=CR⁶-、-N=CR⁶-O-N=CR⁶-、-CR⁶=N-O-、-CR⁶=N-O-CR⁶=N-O-、-O-N=CR⁶-CR⁶=N-O-、-CR⁶=N-NR⁶-または-O-N=CR⁶-CR⁶=N-NR⁶-であり、

Q'、Q'およびQ'は、各々独立に、=O、=S、=N-R'または=C(R⁹)(R⁹)であり、

Q'およびQ'は、各々独立に=Oまたは=Sであり、

Q'は、-S-または-O-であり、

Q'は、各々独立に、=N-または=CH-であり、

Xは、ハロゲン、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ、C₁～C₆アルキルチオ、C₁～C₆アルキルアミノ、(C₁～C₆アルキル)アミノ、NO₂、CN、ホルミル、OH、SH、NU'U'、C₁～C₆アルコキシカルボニル、C₁～C₆アルキルカルボニル、C₁～C₆ハロアルキルカルボニル、R⁶で置換されていてもよいフェニルカルボニルまたはC₁～C₆アルキルカルボニルオキシであり（ただし、置換するXが、2個以上の場合には同一か相互に異なってもよい。）、

R'、R'およびR'は、各々独立に、水素原子、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₃～C₆シクロアルキル、C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルキルスルフェニルC₁～C₆アルキル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルまたはR'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルキルであり、

R'は、水素原子、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₃～C₆シクロアルキル、C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルキルスルフェニルC₁～

～C₆アルキル、R'で置換されていてもよいフェニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルまたはR'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルキルであり、

R'およびR''は、各々独立に、ハロゲン、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆シクロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルキルスルフェニルC₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルコキシ、C₁～C₆アルキルスルフェニル、C₁～C₆アルキルスルフィニル、C₁～C₆アルキルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキルスルフェニル、C₁～C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₆ハロアルケニル、C₁～C₆ハロアルケニルオキシ、C₁～C₆ハロアルケニルオキシ、C₁～C₆アルケニルスルフェニル、C₁～C₆アルケニルスルフィニル、C₁～C₆アルケニルスルホニル、C₁～C₆ハロアルケニルスルフェニル、C₁～C₆ハロアルケニルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキニル、C₁～C₆ハロアルキニルオキシ、C₁～C₆ハロアルキニルオキシ、C₁～C₆アルキニルスルフェニル、C₁～C₆アルキニルスルフィニル、C₁～C₆アルキニルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキニルスルホニル、N O₂、CN、ホルミル、OH、SH、SCN、C₁～C₆アルコキシカルボニル、C₁～C₆ハロアルコキシカルボニル、C₁～C₆アルキルカルボニル、C₁～C₆ハロアルキルカルボニル、C₁～C₆アルキルカルボニルオキシ、R'で置換されていてもよいフェニル、R'で置換されていてもよいフェニルスルホニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリール、R'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルキル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールスルホニル、R'で置換されていてもよいフェニルカルボニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニルまたは-N U'U'であり、

但し、R'は水素原子であってもよく、

R'は、水素原子、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆シクロア

ルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルキルスルフェニルC₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルキルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキルスルホニル、C₁～C₆アルキルカルボニル、C₁～C₆ハロアルキルカルボニル、R'で置換されていてもよいフェニル、R'で置換されていてもよいフェノキシ、R'で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキル、R'で置換されていてもよいフェニルスルホニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルコキシ、R'で置換されていてもよいフェニルカルボニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリール、R'で置換されていてもよいヘテロアリールオキシ、R'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルキル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニル、R'で置換されていてもよいフェノキシカルボニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールオキシカルボニルまたはR'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルキルカルボニルであり、

R⁸およびR⁹は、各々独立に、水素原子、ハロゲン、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆アルキルスルフェニル、C₁～C₆アルケニル、NO₂、C_N、ホルミルまたはC₁～C₆アルコキシカルボニルであり、

R¹⁰は、水素原子、ハロゲン、R¹¹、-OR¹¹、-SR¹¹、-SOR¹¹、または-SO₂R¹¹であり、

R¹¹は、水素原子、R¹⁴またはCNであり、

R¹²は、水素原子またはR¹⁴であり、

R¹³は、水素原子、ハロゲン、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆シクロアルキル、C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルケニルまたはC₁～C₆アルキニルであり、

R¹⁴は、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆アルケニル、C₁～C₆ハロアルケニル、C₁～C₆アルキニル、C₁～C₆ハロアルキニル、C₁～C₆シクロアルキル、C₁～C₆アルキルカルボニルまたはC₁～C₆アルコキシカルボニルであり、

Y' は、ハロゲン、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルキル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆シクロアルキル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルケニル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルキニル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルコキシ、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルコキシ、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルケニルオキシ、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルキニルオキシ、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルキルスルフェニル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルケニルスルフェニル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルキニルスルフェニル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルケニルスルフィニル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルキニルスルフィニル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルキルスルホニル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルケニルスルホニル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルキニルスルホニル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルコキカルボニル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルキルカルボニルオキシ、R^bで置換されていてもよいフェニル、R^bで置換されていてもよいフェノキシ、R^bで置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキル、R^bで置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルコキシ、R^bで置換されていてもよいフェニルスルホニル、R^bで置換されていてもよいフェニルスルフィニル、R^bで置換されていてもよいフェニルスルフェニル、R^bで置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルスルフィニル、R^bで置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルスルホニル、R^bで置換されていてもよいヘテロアリール、R^bで置換されていてもよいヘテロアリールオキシ、R^bで置換されていてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルキル、R^bで置換されていてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルコキシ、R^bで置換されていてもよいヘテロアリールスルフィニル、R^bで置換されていてもよいヘテロアリールスルホニル、R^bで置換されていてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルキルスルフェニル、R^bで置換されていてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルキルスルフィニル、R^bで置換されていてもよいヘテロア

リールC₁～C₆アルキルスルホニル、R^aで置換されていてもよいフェニルカルボニル、R^aで置換されていてもよいフェニルカルボニルオキシ、R^aで置換されていてもよいフェノキシカルボニル、R^aで置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルカルボニル、R^aで置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルカルボニルオキシ、R^aで置換されていてもよいヘテロアリールカルボニル、R^aで置換されていてもよいヘテロアリールカルボニルオキシ、R^aで置換されていてもよいヘテロアリールオキシカルボニル、R^aで置換されていてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルキルカルボニル、R^aで置換されていてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルキルカルボニルオキシ、NO₂、CN、ホルミルまたはナフチルであり、

R^aは、ハロゲン、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆シクロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルキルスルフェニルC₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルコキシ、C₁～C₆アルキルスルフェニル、C₁～C₆アルキルスルフィニル、C₁～C₆アルキルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキルスルフェニル、C₁～C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₆ハロアルキルスルホニル、C₁～C₆アルケニル、C₁～C₆ハロアルケニル、C₁～C₆アルケニルオキシ、C₁～C₆ハロアルケニルオキシ、C₁～C₆アルケニルスルフェニル、C₁～C₆アルケニルスルフィニル、C₁～C₆アルケニルスルホニル、C₁～C₆ハロアルケニルスルフェニル、C₁～C₆ハロアルケニルスルフィニル、C₁～C₆アルキニル、C₁～C₆ハロアルキニル、C₁～C₆アルキニルオキシ、C₁～C₆ハロアルキニルオキシ、C₁～C₆アルキニルスルフェニル、C₁～C₆アルキニルスルフィニル、C₁～C₆アルキニルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキニルスルフェニル、C₁～C₆ハロアルキニルスルフィニル、C₁～C₆ハロアルキニルスルホニル、NO₂、CN、ホルミル、SH、OH、SCN、C₁～C₆アルコキシカルボニル、C₁～C₆アルキルカルボニル、C₁～C₆ハロアルキルカルボニル、C₁～C₆アルキルカルボニルオキシ、フェニルまたは-NU^bU^cであって、置換するR^aの数は1ないし5個であり（ただし、R^aが2個以上の場合は同一か相互に異なってもよい）、

R^bは、ハロゲン、C₁～C₆シクロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆アル

コキシC₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆アルキルスルフェニルC₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ、C₁～C₆アルキルスルフェニル、C₁～C₆アルキルスルフィニル、C₁～C₆アルキルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキルスルフェニル、C₁～C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₆ハロアルキルスルホニル、C₁～C₆アルケニルオキシ、C₁～C₆ハロアルケニルオキシ、C₁～C₆アルケニルスルフェニル、C₁～C₆アルケニルスルフィニル、C₁～C₆アルケニルスルホニル、C₁～C₆ハロアルケニルスルフェニル、C₁～C₆ハロアルケニルスルフィニル、C₁～C₆ハロアルケニルスルホニル、C₁～C₆アルキニルオキシ、C₁～C₆ハロアルキニルオキシ、C₁～C₆アルキニルスルフェニル、C₁～C₆アルキニルスルフィニル、C₁～C₆アルキニルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキニルスルフェニル、C₁～C₆ハロアルキニルスルフィニル、C₁～C₆ハロアルキニルスルホニル、C₁～C₆アルコキシカルボニル、C₁～C₆アルキルカルボニル、C₁～C₆ハロアルキルカルボニル、C₁～C₆アルキルカルボニルオキシ、R'で置換されていてもよいフェニル、R'で置換されていてもよいフェノキシ、R'で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルコキシ、R'で置換されていてもよいフェニルスルホニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルスルホニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリール、R'で置換されていてもよいヘテロアリールオキシ、R'で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニル、R'で置換されていてもよいフェノキシカルボニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルカルボニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールオキシカルボニルまたはR'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルキルカルボニルまたは-NU'U'であるか、あるいは、酸素原子、窒素原子または硫黄原子から選ばれた1から4個のヘテロ原子を含んでいてもよい3から7員環であって、置換するR'の数は1ないし8個であり（ただし、R'が2個以上の場合は同一か相互に異なってよい）、

R'は、ハロゲン、R'で置換されていてもよいC₁～C₆アルキル、R'で置換されていてもよいC₁～C₆シクロアルキル、R'で置換されていてもよいC₁～C₆ア

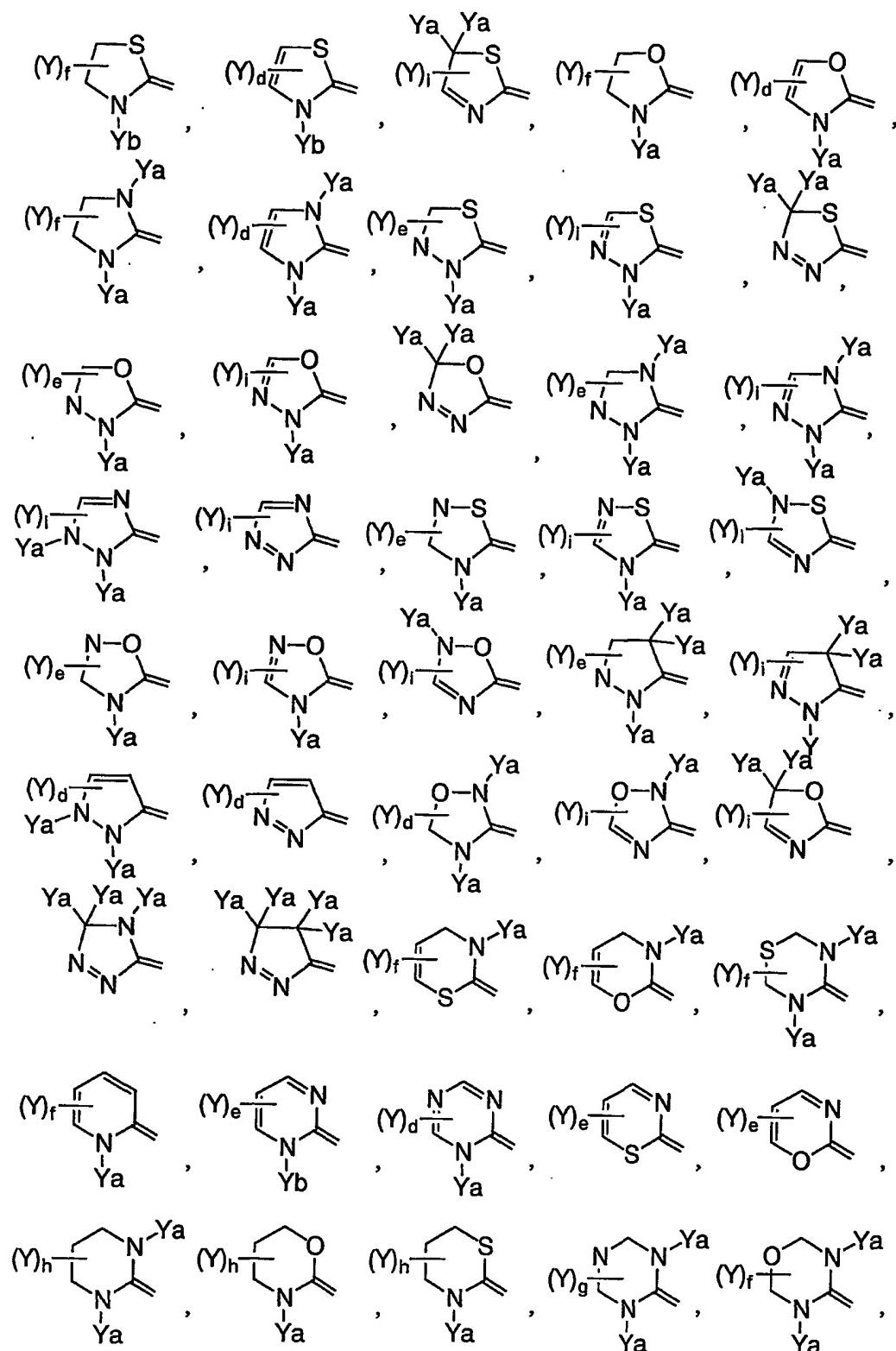
もよいヘテロアリールC₁～C₆アルキルスルホニル、R'で置換されていてもよいフェニルカルボニル、R'で置換されていてもよいフェニルカルボニルオキシ、R'で置換されていてもよいフェノキシカルボニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルカルボニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルカルボニルオキシ、R'で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニルオキシカルボニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルキルカルボニルオキシまたは-N(U')_nU'であり、置換するR'の数は1ないし5個であり（ただし、R'が2個以上の場合は同一か相互に異なってもよい）。

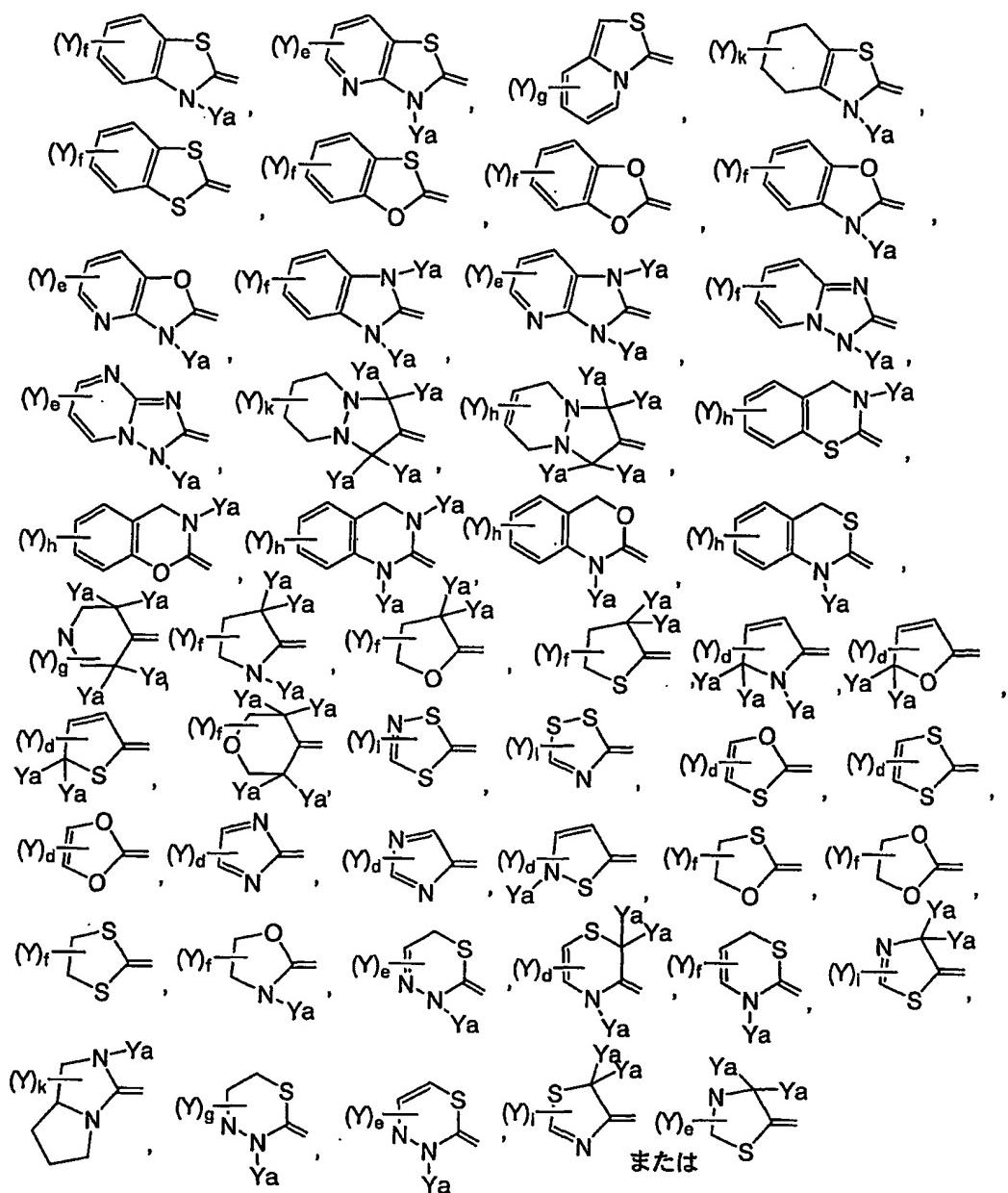
U'およびU'は、各々独立に、水素原子、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆シクロアルキル、C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルキルスルフェニルC₁～C₆アルキル、ホルミル、C₁～C₆アルキルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキルスルホニル、C₁～C₆アルコキシカルボニル、C₁～C₆アルキルカルボニルまたはC₁～C₆ハロアルキルカルボニルであるか、あるいはU'およびU'が一緒になって酸素原子、窒素原子または硫黄原子から選ばれた1から4個のヘテロ原子を含んでいてもよい3から7員環であり、

nは、置換基の数を表し、0から4であり、

pは、繰り返しの数を表し、0から2である。]で表されるヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

[2] Aが





であり、 d は、置換基の数を表し、0から2であり、

eは、置換基の数を表し、0から3であり、

f は、置換基の数を表し、0 から 4 であり、

g は、置換基の数を表し、0 から 5 であり、

これは、置換基の数を表し、0から6であり。

i は、置換基の数を表し、0 から 1 であり、

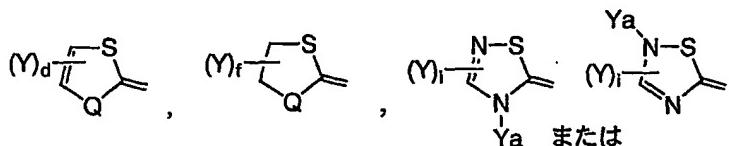
j は、置換基の数を表し、0 から 7 であり、

k は、置換基の数を表し、0 から 8 であり、

Y_a、Y_bおよびYは、互いに独立にY' - D - (C₆H₅)_p-であるか（ただし、YまたはY_aが2個以上の時は、Y_aどうしまたはYどうしは互いに同一または異なってもよい。）、Aの同一炭素原子上に置換した2個のYまたはY_aにより、該炭素原子とともに酸素原子、窒素原子または硫黄原子を各々1～3個含んでいてもよい3～7員環またはC=Q'を形成し、

Yは更に水素原子を表してもよい、〔1〕記載のヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

〔3〕 Aが



を表し、Qは酸素原子、硫黄原子またはN-Y_bを表し、Y、Y_a、Y_b、d、fおよびiは〔2〕と同じ意味を表す、〔1〕または〔2〕記載のヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

〔4〕 Dが単結合であり、pが0である〔1〕から〔3〕のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

〔5〕 Y'がハロゲン、R^bで置換されていてもよいC₁～C₁₂アルキル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₁₂アルコキシ、R^bで置換されていてもよいC₁～C₁₂アルキルスルフェニル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₁₂アルキルスルフィニル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₁₂アルキルスルホニル、R^bで置換されていてもよいフェニルまたはR^cで置換されていてもよいヘテロアリールである、

〔1〕から〔4〕のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

〔6〕 GがG¹、G²、G¹⁶または-B²-A¹aである〔1〕から〔5〕のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

[7] Gが $-N(OR')$ - C(=O) Zまたは $-N(R') - C(=O) Z$ である〔1〕から〔5〕のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

[8] Y'が少なくともひとつのR'で置換されたフェニルまたは少なくともひとつのR'で置換されたヘテロアリールであり、R'のうち少なくともひとつがトリフルオロメチルであり、ただし、GがG'のときはnが1以上である、〔1〕から〔7〕のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

[9] 農薬として許容される塩が塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩、ギ酸塩、酢酸塩またはシュウ酸塩である、〔1〕から〔8〕のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物の塩。

[10] 〔1〕から〔9〕のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物およびその農薬として許容される塩から選ばれる一種以上を有効成分として含有する農薬。

[11] 〔1〕から〔9〕のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物およびその農薬として許容される塩から選ばれる一種以上を有効成分として含有する殺菌剤。

[12] 〔1〕から〔9〕のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物およびその農薬として許容される塩から選ばれる一種以上を有効成分として含有する殺虫剤。

ただし、本化合物に、立体異性体、幾何異性体、互変異性体、ジアステレオマーが存在する場合には、それぞれの異性体並びにそれらの混合物の全てを包括する。

発明を実施するための最良の形態

式(1)で表される本発明化合物の各置換基を、以下に例示する。

なお、略号はそれぞれ以下の意味を示す。

Meはメチル基を、Etはエチル基を、Prはプロピル基を、Buはブチル基を、Penはペンチル基を、Hexはヘキシル基を、Hepはヘプチル基を、Octはオクチル基を、Nonはノニル基を、Decはデシル基を、Undecはウンデシル基を、Dodecはドデシ

ル基を、*n*はノーマルを、*i*はイソを、*s*はセカンダリーを、*t*はターシャリーを、*c*はシクロをそれぞれ表し、Phはフェニル基を表し、フェニル基の表記において例えば2-Cl-Phは2-クロロフェニル基を表し、2-MeO-3-Me-Phは2-メトキシ-3-メチルフェニル基を表す。

R¹、*R²*、*R³*、*R⁴*、*R⁵*、*R⁶*、*R⁷*、*R⁸*、*R⁹*、*R¹³*、*R¹⁴*、*R^a*、*X*、*U¹*および*U²*の定義におけるC₁～C₆アルキルとしては、直鎖または分岐状のアルキルとしてメチル、エチル、*n*-プロピル、*i*-プロピル、*n*-ブチル、*i*-ブチル、*t*-ブチル、*s*-ブチル、*n*-ペンチル、*n*-ヘキシリ、2-エチルプロピル、2,2-ジメチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、1,1,2-トリメチルプロピル、1,2,2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピル、1-エチル-2-メチルプロピル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、1,1-ジメチルブチル、1,2-ジメチルブチル、1,3-ジメチルブチル、2,2-ジメチルブチル、2,3-ジメチルブチル、3,3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチルおよび4-メチルペンチル等があげられる。

R⁵、*R⁶*、*R⁸*、*R⁹*、*R¹⁰*、*R¹³*、*R^a*、*R^b*、*R^c*、*X*およびY'の定義におけるハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子およびヨウ素原子があげられる。

R¹、*R²*、*R³*、*R⁴*、*R⁵*、*R⁶*、*R⁷*、*R¹³*、*R¹⁴*、*R^a*、*X*、*U¹*および*U²*の定義におけるC₁～C₆ハロアルキルとしては、直鎖または分岐状のハロアルキルとしてフルオロメチル、クロロメチル、ブロモメチル、ヨードメチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、ブロモジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、1-クロロエチル、1-プロモエチル、1-ヨードエチル、1-フルオロエチル、2-クロロエチル、2-ブロモエチル、2-ヨードエチル、2-フルオロエチル、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、2,2,2-トリクロロエチル、ペンタフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロ-1-クロロエチル、3-フルオロプロピル、3-クロロプロピル、1-フルオロ-i-プロピル、1-クロロ-i-プロピル、ヘプタフルオロプロピル、1,1,2,2,3,3-ヘキサフルオロ-n-プロピル、4-クロロブチル、4-フルオロブチル、5-クロロペンチル、5-フルオロペンチル、6-クロロヘキシリおよび6-フルオロヘキシリ等があげられる

。

R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R¹³、R¹⁴、R^a、R^b、U¹およびU²の定義におけるC₃～C₆シクロアルキルとしては、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチルおよびシクロヘキシル等があげられる。

R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R^a、R^bおよびXの定義におけるC₁～C₆アルコキシとしては、直鎖または分岐状のアルコキシとしてメトキシ、エトキシ、n-ブロポキシ、i-プロポキシ、n-ブトキシ、i-ブトキシ、s-ブトキシ、t-ブトキシ、n-ペンチルオキシ、n-ヘキシルオキシ、1,1-ジメチルプロポキシ、1,2-ジメチルプロポキシ、2,2-ジメチルプロポキシ、1-エチルプロポキシ、1,1,2-トリメチルプロポキシ、1,2,2-トリメチルプロポキシ、1-エチル-1-メチルプロポキシ、1-エチル-2-メチルプロポキシ-1-メチルブトキシ、2-メチルブトキシ、3-メチルブトキシ、1-エチルブトキシ、2-エチルブトキシ、1,1-ジメチルブトキシ、1,2-ジメチルブトキシ、1,3-ジメチルブトキシ、2,2-ジメチルブトキシ、2,3-ジメチルブトキシ、3,3-ジメチルブトキシ、1-メチルペンチルオキシ、2-メチルペンチルオキシ、3-メチルペンチルオキシおよび4-メチルペンチルオキシ等があげられる

。

R⁵、R⁶、R^a、R^bおよびXの定義におけるC₁～C₆ハロアルコキシとしては、C₁～C₆直鎖状または分岐状のハロアルコキシがあげられ、フルオロメトキシ、クロロメトキシ、ブロモメトキシ、ヨードメトキシ、ジクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、ブロモジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、1-クロロエトキシ、1-ブロモエトキシ、1-ヨードエトキシ、1-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2-ブロモエトキシ、2-ヨードエトキシ、2-フルオロエトキシ、2,2-ジフルオロエトキシ、2,2,2-トリフルオロエトキシ、2,2,2-トリクロロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、2,2,2-トリフルオロ-1-クロロエトキシ、1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ、3-ブロモプロポキシ、1-フルオロ-i-プロポキシ、1-クロロ-i-プロポキシ、3-フルオロプロポキシ、3-クロロプロポキシ、ヘプタフルオロプロポキシ、1,1,2,2,3,3-ヘキサフルオロプロポキシ、4-クロロブトキシ、4-フルオロブトキシ、5-クロロペンチルオキシ、5-フルオロペンチルオキシ、

6-クロロヘキシルオキシおよび6-フルオロヘキシルオキシ等があげられる。

R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^9 、 R^a 、 R^b およびXの定義における $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフェニルとしては、直鎖または分岐状のアルキルスルフェニルとしてメチルチオ、エチルチオ、n-プロピルチオ、i-プロピルチオ、n-ブチルチオ、i-ブチルチオ、s-ブチルチオ、t-ブチルチオ、n-ペンチルチオおよびn-ヘキシルチオ等があげられる。

R^5 、 R^6 、 R^8 および R^b の定義における $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニルとしては、直鎖または分岐状のアルキルスルフィニルとしてメチルスルフィニル、エチルスルフィニル、n-プロピルスルフィニル、i-プロピルスルフィニル、n-ブチルスルフィニル、i-ブチルスルフィニル、s-ブチルスルフィニル、t-ブチルスルフィニル、n-ペンチルスルフィニルおよびn-ヘキシルスルフィニル等があげられる。

R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^b 、 U^1 および U^2 の定義における $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニルとしては、直鎖または分岐状のアルキルスルホニルとしてメチルスルホニル、エチルスルホニル、n-プロピルスルホニル、i-プロピルスルホニル、n-ブチルスルホニル、i-ブチルスルホニル、s-ブチルスルホニル、t-ブチルスルホニル、n-ペンチルスルホニルおよびn-ヘキシルスルホニル等があげられる。

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{13} 、 R^a 、 U^1 および U^2 の定義における $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルキルとしては、メトキシメチル、エトキシメチル、n-プロポキシメチル、i-プロポキシメチル、n-ブトキシメチル、i-ブトキシメチル、s-ブトキシメチル、t-ブトキシメチル、n-ペンチルオキシメチル、2-メトキシエチル、3-エトキシプロピルおよび3-メトキシプロピル等があげられる。

R^b の定義における $C_1 \sim C_6$ アルコキシ $C_1 \sim C_6$ アルコキシとしては、メトキシメトキシ、エトキシメトキシ、n-プロポキシメトキシ、i-プロポキシメトキシ、n-ブトキシメトキシ、i-ブトキシメトキシ、s-ブトキシメトキシ、t-ブトキシメトキシ、n-ペンチルオキシメトキシ、2-メトキシエトキシ、3-エトキシプロポキシおよび3-メトキシプロポキシ等があげられる。

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^a 、 U^1 および U^2 の定義における C_1

～C₆アルキルスルフェニルC₁～C₆アルキルとしては、直鎖状または分岐状のアルキルスルフェニルアルキルとして、メチルチオメチル、エチルチオメチル、n-プロピルチオメチル、i-プロピルチオメチル、n-ブチルチオメチル、i-ブチルチオメチル、s-ブチルチオメチル、t-ブチルチオメチル、n-ペンチルチオメチル、2-メチルチオエチル、3-エチルチオプロピルおよび3-メチルチオプロピル等があげられる。

R^bの定義におけるC₁～C₆アルキルスルフェニルC₁～C₆アルコキシとしては、メチルチオメトキシ、エチルチオメトキシ、n-プロピルチオメトキシ、i-プロピルチオメトキシ、n-ブチルチオメトキシ、i-ブチルチオメトキシ、s-ブチルチオメトキシ、t-ブチルチオメトキシ、n-ペンチルチオメトキシ、2-メチルチオエトキシ、3-エチルチオプロポキシおよび3-メチルチオプロポキシ等があげられる。

R⁵、R⁶、R^aおよびR^bの定義におけるC₁～C₆ハロアルキルスルフェニルとしては、直鎖状または分岐状のハロアルキルチオとしてフルオロメチルチオ、クロロジフルオロメチルチオ、プロモジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、トリクロロメチルチオ、2,2,2-トリフルオロエチルチオ、1,1,2,2-テトラフルオロエチルチオ、2-フルオロエチルチオ、ペンタフルオロエチルチオおよび1-フルオロ-i-プロピルチオ等があげられる。

R⁵、R⁶、R^aおよびR^bの定義におけるC₁～C₆ハロアルキルスルフィニルとしては、直鎖状または分岐状のハロアルキルスルフィニルとしてフルオロメチルスルフィニル、クロロジフルオロメチルスルフィニル、プロモジフルオロメチルスルフィニル、トリフルオロメチルスルフィニル、トリクロロメチルスルフィニル、2,2,2-トリフルオロエチルスルフィニル、1,1,2,2-テトラフルオロエチルスルフィニル、2-フルオロエチルスルフィニル、ペンタフルオロエチルスルフィニルおよび1-フルオロ-i-プロピルスルフィニル等があげられる。

R⁵、R⁶、R⁷、R^a、R^b、U¹およびU²の定義におけるC₁～C₆ハロアルキルスルホニルとしては、直鎖状または分岐状のハロアルキルスルホニルとしてフルオロメチルスルホニル、クロロジフルオロメチルスルホニル、プロモジフルオロメチルスルホニル、トリフルオロメチルスルホニル、トリクロロメチルスルホ

ニル、2,2,2-トリフルオロエチルスルホニル、1,1,2,2-テトラフルオロエチルスルホニル、2-フルオロエチルスルホニル、ペンタフルオロエチルスルホニルおよび1-フルオロ-i-プロピルスルホニル等があげられる。

R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^9 、 R^{13} 、 R^{14} および R° の定義における $C_2 \sim C_6$ アルケニルとしては、直鎖または分岐状のアルケニルとしてエテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1,1-ジメチル-2-プロペニル、1,2-ジメチル-2-プロペニル、1-エチル-2-プロペニル、1-メチル-2-ブテニル、2-メチル-2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル、2-メチル-3-ブテニル、3-メチル-3-ブテニル、1,1-ジメチル-2-ブテニル、1,1-ジメチル-3-ブテニル、1,2-ジメチル-2-ブテニル、1,2-ジメチル-3-ブテニル、1,3-ジメチル-2-ブテニル、1,3-ジメチル-3-ブテニル、2,3-ジメチル-2-ブテニル、2,3-ジメチル-3-ブテニル、1-エチル-2-ブテニル、1-エチル-3-ブテニル、2-エチル-2-ブテニル、2-エチル-3-ブテニル、1-メチル-2-ペンテニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-2-ペンテニル、4-メチル-2-ペンテニル、1-メチル-3-ペンテニル、2-メチル-3-ペンテニル、3-メチル-3-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル、1-メチル-4-ペンテニル、2-メチル-4-ペンテニル、3-メチル-4-ペンテニル、4-メチル-4-ペンテニル、1,1,2-トリメチル-2-プロペニルおよび1-エチル-1-メチル-2-プロペニル等が挙げられる。

R^5 、 R^6 、 R^{14} および R° の定義における $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルとしては、直鎖または分岐状のハロアルケニルとして2-クロロエテニル、2-ブロモエテニル、2,2-ジクロロエテニル、3-クロロ-2-プロペニル、3-フルオロ-2-プロペニル、3-ブロモ-2-プロペニル、3-ヨード-2-プロペニル、3,3-ジクロロ-2-プロペニル、3,3-ジフルオロ-2-プロペニル、4-クロロ-2-ブテニル、4,4-ジクロロ-3-ブテニルおよび4,4-ジフルオロ-3-ブテニル等が挙げられる。

R^5 、 R^6 、 R° および R° の定義における $C_2 \sim C_6$ アルケニルオキシとしては、直鎖または分岐状のアルケニルオキシとして1-メチルエテニルオキシ、2-プロペニルオキシ、1-メチル-2-プロペニルオキシ、2-ブテニルオキシ、3-ブテニルオ

キシおよび2-メチル-2-プロペニルオキシ等があげられる。

R⁵、R⁶、R^a、R^bおよびXおよびの定義におけるC₂～C₆ハロアルケニルオキシとしては、直鎖または分岐状のハロアルケニルオキシとして2-クロロエテニルオキシ、2-プロモエテニルオキシ、2,2-ジクロロエテニルオキシ、3-クロロ-2-プロペニルオキシ、3-フルオロ-2-プロペニルオキシ、3-プロモ-2-プロペニルオキシ、3-ヨード-2-プロペニルオキシ、3,3-ジクロロ-2-プロペニルオキシ、3,3-ジフルオロ-2-プロペニルオキシ、4-クロロ-2-ブテニルオキシ、4,4-ジクロロ-3-ブテニルオキシおよび4,4-ジフルオロ-3-ブテニルオキシ等が挙げられる。

R⁵、R⁶、R^aおよびR^bの定義におけるC₂～C₆アルケニルスルフェニルとしては、直鎖または分岐状のアルケニルスルフェニルとして1-メチルエテニルチオ、2-プロペニルチオ、1-メチル-2-プロペニルチオ、2-ブテニルチオ、3-ブテニルチオおよび2-メチル-2-プロペニルチオ等があげられる。

R⁵、R⁶、R^aおよびR^bの定義におけるC₂～C₆アルケニルスルフィニルとしては、直鎖または分岐状のアルケニルスルフィニルとして1-メチルエテニルスルフィニル、2-プロペニルスルフィニル、1-メチル-2-プロペニルスルフィニル、2-ブテニルスルフィニル、3-ブテニルスルフィニルおよび2-メチル-2-プロペニルスルフィニル等があげられる。

R⁵、R⁶、R^aおよびR^bの定義におけるC₂～C₆アルケニルスルホニルとしては、直鎖または分岐状のアルケニルスルホニルとして1-メチルエテニルスルホニル、2-プロペニルスルホニル、1-メチル-2-プロペニルスルホニル、2-ブテニルスルホニル、3-ブテニルスルホニルおよび2-メチル-2-プロペニルスルホニル等があげられる。

R⁵、R⁶、R^aおよびR^bの定義におけるC₂～C₆ハロアルケニルスルフェニルとしては、直鎖または分岐状のハロアルケニルスルフェニルとして2-クロロエテニルチオ、2-プロモエテニルチオ、2,2-ジクロロエテニルチオ、3-クロロ-2-プロペニルチオ、3-フルオロ-2-プロペニルチオ、3-プロモ-2-プロペニルチオ、3-ヨード-2-プロペニルチオ、3,3-ジクロロ-2-プロペニルチオ、3,3-ジフルオロ-2-プロペニルチオ、4-クロロ-2-ブテニルチオ、4,4-ジクロロ-3-ブテニルチオおよび4,4-ジフルオロ-3-ブテニルチオ等が挙げられる。

R^5 、 R^6 、 R^8 および R^9 の定義における $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルスルフィニルとしては、直鎖または分岐状のハロアルケニルスルフィニルとして2-クロロエテニルスルフィニル、2-プロモエテニルスルフィニル、2,2-ジクロロエテニルスルフィニル、3-クロロ-2-プロペニルスルフィニル、3-フルオロ-2-プロペニルスルフィニル、3-プロモ-2-プロペニルスルフィニル、3-ヨード-2-プロペニルスルフィニル、3,3-ジクロロ-2-プロペニルスルフィニル、3,3-ジフルオロ-2-プロペニルスルフィニル、4-クロロ-2-ブチニルスルフィニル、4,4-ジクロロ-3-ブチニルスルフィニルおよび4,4-ジフルオロ-3-ブチニルスルフィニル等が挙げられる。

R^5 、 R^6 、 R^8 および R^9 の定義における $C_2 \sim C_6$ ハロアルケニルスルホニルとしては、直鎖または分岐状のハロアルケニルスルホニルとして2-クロロエテニルスルホニル、2-プロモエテニルスルホニル、2,2-ジクロロエテニルスルホニル、3-クロロ-2-プロペニルスルホニル、3-フルオロ-2-プロペニルスルホニル、3-プロモ-2-プロペニルスルホニル、3-ヨード-2-プロペニルスルホニル、3,3-ジクロロ-2-プロペニルスルホニル、3,3-ジフルオロ-2-プロペニルスルホニル、4-クロロ-2-ブチニルスルホニル、4,4-ジクロロ-3-ブチニルスルホニルおよび4,4-ジフルオロ-3-ブチニルスルホニル等が挙げられる。

R^5 、 R^6 、 R^{13} 、 R^{14} および R^8 の定義における $C_2 \sim C_6$ アルキニルとしては、直鎖または分岐状のアルキニルとしてエチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-メチル-2-プロピニル、1,1-ジメチル-2-プロピニル、1-メチル-1-エチル-2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-ブチニル、1-メチル-3-ブチニル、2-メチル-3-ブチニル、1,1-ジメチル-2-ブチニル、1,1-ジメチル-3-ブチニル、1,2-ジメチル-3-ブチニル、2,2-ジメチル-3-ブチニル、1-エチル-2-ブチニル、1-エチル-3-ブチニル、2-エチル-3-ブチニル、1-ペンチニル、2-ペンチニル、3-ペンチニル、4-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、1-メチル-4-ペンチニル、2-メチル-3-ペンチニル、2-メチル-4-ペンチニル、3-メチル-4-ペンチニル、4-メチル-2-ペンチニルおよびヘキシニル等があげられる。

R^5 、 R^6 、 R^{14} および R^8 の定義における $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニルとしては、直鎖または分岐状のハロアルキニルとしてクロロエチニル、プロモエチニル、ヨードエチニル、3-クロロ-2-プロピニル、3-プロモ-2-プロピニル、3-ヨード-2-

プロピニル、4-プロモ-3-ブチニル、4-ヨード-3-ブチニルおよび6-ヨード-5-ヘキシニル等が挙げられる。

R^5 、 R^6 、 R^a および R^b の定義における $C_2 \sim C_6$ アルキニルオキシとしては、直鎖または分岐状のアルキニルオキシとしてエチニルオキシ、2-プロピニルオキシ、1-メチル-2-プロピニルオキシ、1,1-ジメチル-2-プロピニルオキシ、1-メチル-1-エチル-2-プロピニルオキシ、2-ブチニルオキシ、3-ブチニルオキシ、1-メチル-2-ブチニルオキシ、1,1-ジメチル-2-ブチニルオキシ、1-ペンチニルオキシ、2-ペンチニルオキシ、3-ペンチニルオキシ、4-ペンチニルオキシおよびヘキシニルオキシ等があげられる。

R^5 、 R^6 、 R^a および R^b の定義における $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニルオキシとしては、直鎖または分岐状のハロアルキニルオキシとしてクロロエチニルオキシ、ブロモエチニルオキシ、ヨードエチニルオキシ、3-クロロ-2-プロピニルオキシ、3-ブロモ-2-プロピニルオキシ、3-ヨード-2-プロピニルオキシ、4-ブロモ-3-ブチニルオキシ、4-ヨード-3-ブチニルオキシおよび6-ヨード-5-ヘキシニルオキシ等があげられる。

R^5 、 R^6 、 R^a および R^b の定義における $C_2 \sim C_6$ アルキニルスルフェニルとしては、直鎖または分岐状のアルキニルスルフェニルとしてエチニルチオ、2-プロピニルチオ、1-メチル-2-プロピニルチオ、1,1-ジメチル-2-プロピニルチオ、1-メチル-1-エチル-2-プロピニルチオ、2-ブチニルチオ、3-ブチニルチオ、1-メチル-2-ブチニルチオ、1,1-ジメチル-2-ブチニルチオ、1-ペンチニルチオ、2-ペンチニルチオ、3-ペンチニルチオ、4-ペンチニルチオおよびヘキシニルチオ等があげられる。

R^5 、 R^6 、 R^a および R^b の定義における $C_2 \sim C_6$ アルキニルスルフィニルとしては、直鎖または分岐状のアルキニルスルフィニルとしてエチニルスルフィニル、2-プロピニルスルフィニル、1-メチル-2-プロピニルスルフィニル、1,1-ジメチル-2-プロピニルスルフィニル、1-メチル-1-エチル-2-プロピニルスルフィニル、2-ブチニルスルフィニル、3-ブチニルスルフィニル、1-メチル-2-ブチニルスルフィニル、1,1-ジメチル-2-ブチニルスルフィニル、1-ペンチニルスルフィニル、2-ペンチニルスルフィニル、3-ペンチニルスルフィニル、4-ペンチニルス

ルフィニルおよびヘキシニルスルフィニル等があげられる。

R^5 、 R^6 、 R^8 および R^9 の定義における $C_2 \sim C_6$ アルキニルスルホニルとしては、直鎖または分岐状のアルキニルスルホニルとしてエチニルスルホニル、2-プロピニルスルホニル、1-メチル-2-プロピニルスルホニル、1,1-ジメチル-2-プロピニルスルホニル、1-メチル-1-エチル-2-プロピニルスルホニル、2-ブチニルスルホニル、3-ブチニルスルホニル、1-メチル-2-ブチニルスルホニル、1,1-ジメチル-2-ブチニルスルホニル、1-ペンチニルスルホニル、2-ペンチニルスルホニル、3-ペンチニルスルホニル、4-ペンチニルスルホニルおよびヘキシニルスルホニル等があげられる。

R^5 、 R^6 、 R^8 および R^9 の定義における $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニルスルフェニルとしては、直鎖または分岐状のハロアルキニルスルフェニルとしてクロロエチニルチオ、プロモエチニルチオ、ヨードエチニルチオ、3-クロロ-2-プロピニルチオ、3-プロモ-2-プロピニルチオ、3-ヨード-2-プロピニルチオ、4-プロモ-3-ブチニルチオ、4-ヨード-3-ブチニルチオおよび6-ヨード-5-ヘキシニルチオ等があげられる。

R^5 、 R^6 、 R^8 および R^9 の定義における $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニルスルフィニルとしては、直鎖または分岐状のハロアルキニルスルフィニルとしてクロロエチニルスルフィニル、プロモエチニルスルフィニル、ヨードエチニルスルフィニル、3-クロロ-2-プロピニルスルフィニル、3-プロモ-2-プロピニルスルフィニル、3-ヨード-2-プロピニルスルフィニル、4-プロモ-3-ブチニルスルフィニル、4-ヨード-3-ブチニルスルフィニルおよび6-ヨード-5-ヘキシニルスルフィニル等があげられる。

R^5 、 R^6 、 R^8 および R^9 の定義における $C_2 \sim C_6$ ハロアルキニルスルホニルとしては、直鎖または分岐状のハロアルキニルスルホニルとしてクロロエチニルスルホニル、プロモエチニルスルホニル、ヨードエチニルスルホニル、3-クロロ-2-プロピニルスルホニル、3-プロモ-2-プロピニルスルホニル、3-ヨード-2-プロピニルスルホニル、4-プロモ-3-ブチニルスルホニル、4-ヨード-3-ブチニルスルホニルおよび6-ヨード-5-ヘキシニルスルホニル等があげられる。

R^5 、 R^6 、 R^8 、 R^9 、 R^{14} 、 R^a 、 R^b 、 X 、 U^1 および U^2 の定義における C_1

～C₆アルコキシカルボニルとしては、直鎖または分岐状のアルコキシカルボニルとしてメトキシカルボニル、エトキシカルボニル、n-プロポキシカルボニル、i-プロポキシカルボニル、n-ブトキシカルボニル、i-ブトキシカルボニル、s-ブトキシカルボニル、t-ブトキシカルボニル、n-ペンチルオキシカルボニルおよびn-ヘキシリオキシカルボニル等が挙げられる。

R⁵、R⁶、R⁷、R¹⁴、R^a、R^b、X、U¹およびU²の定義におけるC₁～C₆アルキルカルボニルとしては、直鎖または分岐状のアルキルカルボニルとしてアセチル、プロピオニル、n-プロピルカルボニル、i-プロピルカルボニル、n-ブチルカルボニル、i-ブチルカルボニル、s-ブチルカルボニル、t-ブチルカルボニル、n-ペンチルカルボニルおよびn-ヘキシリカルボニル等があげられる。

R⁵、R⁶、R⁷、R^a、R^b、X、U¹およびU²の定義におけるC₁～C₆のハロアルキルカルボニルとしては、直鎖または分岐状のハロアルキルカルボニルとしてクロロアセチル、フルオロアセチル、クロロフルオロアセチル、クロロジフルオロアセチル、ジクロロアセチル、ジフルオロアセチル、トリフルオロアセチル、3,3,3-トリフルオロプロピオニルおよびペンタフルオロプロピオニル等があげられる。

R⁵、R⁶、R^a、R^b、X、U¹およびU²の定義におけるC₁～C₆アルキルカルボニルオキシとしては、直鎖または分岐状のアルキルカルボニルオキシとしてアセチルオキシ、プロピオニルオキシ、n-プロピルカルボニルオキシ、i-プロピルカルボニルオキシ、n-ブチルカルボニルオキシ、i-ブチルカルボニルオキシ、s-ブチルカルボニルオキシ、t-ブチルカルボニルオキシ、n-ペンチルカルボニルオキシおよびn-ヘキシリカルボニルオキシ等があげられる。

R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷およびR^cの定義における、R^aで置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルとしては、直鎖または分岐状のフェニルアルキルとしてベンジル、2-クロロベンジル、3-プロモベンジル、4-クロロベンジル、4-メチルベンジル、4-t-ブチルベンジル、2-メチルベンジル、2-メトキシベンジル、1-フェニルエチル、1-(3-クロロフェニル)エチル、2-フェニルエチル、1-メチル-1-フェニルエチル、1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-フェニルプロピル、2-フェニルプロ

ロピル、3-フェニルプロピル、1-フェニルブチル、2-フェニルブチル、3-フェニルブチル、4-フェニルブチル、1-メチル-1-フェニルプロピル、1-メチル-2-フェニルプロピル、1-メチル-3-フェニルプロピル、2-メチル-2-フェニルプロピル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルプロピル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)プロピル、1-フェニルペンチル、2-フェニルペンチル、3-フェニルペンチル、4-フェニルペンチル、5-フェニルペンチル、1-メチル-1-フェニルブチル、1-メチル-2-フェニルブチル、1-メチル-3-フェニルブチル、1-メチル-4-フェニルブチル、2-メチル-2-フェニルブチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルブチル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ブチル、1-フェニルヘキシル、2-フェニルヘキシル、3-フェニルヘキシル、4-フェニルヘキシル、5-フェニルヘキシル、6-フェニルヘキシル、1-メチル-1-フェニルペンチル、1-メチル-2-フェニルペンチル、1-メチル-3-フェニルペンチル、1-メチル-4-フェニルペンチル、2-メチル-2-フェニルペンチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルペンチルおよび2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ペンチル等があげられる。

R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷およびR[°]の定義におけるR^aで置換されてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルキルとしては、直鎖または分岐状のヘテロアリールアルキルとしてピリジン-2-イルメチル、5-クロロチオフェン-2-イルメチル、1-メチル-3-クロロピラゾール-5-イルメチル、2-(3-メチルフラン-2-イル)エチル、3-(6-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)プロピル、4-(ピリミジン-2-イル)ブチル、5-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)ペンチル、6-(ピロール-1-イル)ヘキシル等が挙げられる。

R³、R⁵、R⁶、R⁷、R[°]およびR[°]の定義におけるR^aで置換されてもよいフェニルとしては、Ph、2-Cl-Ph、3-Cl-Ph、4-Cl-Ph、2-F-Ph、3-F-Ph、4-F-Ph、2-Me-Ph、3-Me-Ph、4-Me-Ph、2-MeO-Ph、3-MeO-Ph、4-MeO-Ph、4-Br-Ph、2,4-Cl₂-Ph、3,4-Cl₂-Ph、2,4,6-Cl₃-Ph、3,4-(MeO)₂-Ph、2-Cl-4-Me-Ph、2-MeO-4-Me-Ph、2-Cl-4-i-Pr-Ph、3-Cl-4-PhCH₂0-Ph、2,4-Me₂-Ph、2,5-Me₂-Ph、2,6-F₂-Ph、2,3,4,5,6-F₅-Ph、4-Et-Ph、4-i-Pr-Ph、4-n-Bu-Ph、4-s-Bu-Ph、4-t-Bu-Ph、4-(t-BuCH₂)-Ph、4-Et(Me)₂C-Ph、4-n-Hex-Ph、4-((Me)₂(CN)C)-Ph、4-(MeCH=CH)-Ph、4-(MeC≡C)-Ph、4-CF₃-Ph、4-CF₃CH₂-Ph、4-(Cl₂C=CHCH₂)-Ph、4-(BrC

$\equiv C$) - Ph, 4-(2, 2-F₂-c-BuCH₂) - Ph, 4-(1-Me-c-Pr) - Ph, 4-i-PrO - Ph, 4-t-BuO - Ph, 4-n-HexO - Ph, 4-MeCC(0)Ph, 4-(CH₂=CHCH₂O) - Ph, 4-CHF₂O - Ph, 4-CBrF₂O - Ph, 4-CF₃O - Ph, 4-CF₃CH₂O - Ph, 4-(CF₂=CHCH₂CH₂O) - Ph, 4-CCl₃CCH₂O - Ph, 4-MeS - Ph, 4-s-BuS - Ph, 4-EtSO - Ph, 4-MeSO₂ - Ph, 4-EtSO₂ - Ph, 4-i-PrSO₂ - Ph, 4-t-BuSO₂ - Ph, 4-(MeCH=CHCH₂S) - Ph, 4-(CH₂=CHCH₂SO) - Ph, 4-(ClCH=CHCH₂SO₂) - Ph, 4-(HC \equiv CCH₂S) - Ph, 4-(HC \equiv CCH₂SO - Ph), 4-(HC \equiv CCH₂SO₂) - Ph, 4-CHF₂S - Ph, 4-CBrF₂S - Ph, 4-CF₃S - Ph, 4-CF₃CH₂S - Ph, 4-CHF₂CF₂S - Ph, 4-CHF₂SO - Ph, 4-CBrF₂SO - Ph, 4-CF₃SO - Ph, 4-CF₃CH₂SO₂ - Ph, 4-CHF₂CF₂SO₂ - Ph, 4-CHF₂SO₂ - Ph, 4-CBrF₂SO₂ - Ph, 4-CF₃SO₂ - Ph, 4-(Cl₂C=CHCH₂S) - Ph, 4-(Cl₂C=CHCH₂SO) - Ph, 4-(Cl₂C=CHCH₂SO₂) - Ph, 4-(BrC \equiv CCH₂S) - Ph, 4-(BrC \equiv CCH₂SO) - Ph, 4-(BrC \equiv CCH₂SO₂) - Ph, 4-CHO - Ph, 4-NO₂ - Ph, 3-CN - Ph, 4-CN - Ph, 4-(Me)₂N - Ph, 4-Me(MeC(0))N - Ph, 4-PhN(Me) - Ph, 4-PhCH₂(MeC(0))N - Ph, 4-MeC(0) - Ph, 4-EtC(0) - Ph, 4-n-PrC(0) - Ph, 4-i-PrC(0) - Ph, 4-i-BuC(0) - Ph, 4-t-BuC(0) - Ph, 4-i-BuCH₂C(0) - Ph, 4-Et(Me)₂CC(0) - Ph, 4-n-HexC(0) - Ph, 4-MeOCH₂ - Ph, 4-EtOCH₂ - Ph, 4-i-PrOCH₂ - Ph, 4-MeSCH₂ - Ph, 4-EtSCH₂ - Ph, 4-i-PrSCH₂ - Ph, 4-CF₃C(0) - Ph, 4-CF₃CF₂C(0) - Ph, 4-MeC(0)O - Ph, 4-EtC(0)O - Ph, 4-n-PrC(0)O - Ph, 4-i-PrC(0)O - Ph, 4-i-BuC(0)O - Ph, 4-t-BuC(0)O - Ph, 4-i-BuCH₂C(0)O - Ph, 4-Et(Me)₂CC(0)O - Ph, 4-n-HexC(0)O - Ph, 4-CF₃C(0)O - Ph, 4-CF₃CF₂C(0)O - Ph, 3,5-Cl₂-Ph, 2,6-Cl₂-Ph, 2,5-Cl₂-Ph, 2,3-Cl₂-Ph, 2,3-F₂-Ph, 2,5-F₂-Ph, 3,4-F₂-Ph, 3,5-F₂-Ph, 2,4-F₂-Ph, 2-CF₃-Ph, 3-(3-Cl-PhCH₂O) - Ph, 2-F-6-CF₃-Ph, 2-F-6-Cl-Ph, 2-F-6-Me-Ph, 2-F-6-MeO-Ph, 2-F-6-OH-Ph, 2-F-6-MeS-Ph, 2-F-5-Cl-Ph, 2-F-5-CF₃-Ph, 2-F-5-Me-Ph, 2-F-5-MeO-Ph, 2-F-5-OH-Ph, 2-F-5-MeS-Ph, 2-F-4-Cl-Ph, 2-F-4-CF₃-Ph, 2-F-4-Me-Ph, 2-F-4-MeO-Ph, 2-F-3-Cl-Ph, 2-F-3-Me-Ph, 2-F-3-MeO-Ph, 3-F-2-Cl-Ph, 3-F-2-Me-Ph, 3-F-2-MeO-Ph, 3-F-4-Cl-Ph, 3-F-4-Me-Ph, 3-F-4-MeO-Ph, 3-F-5-Cl-Ph, 3-F-5-Me-Ph, 3-F-5-MeO-Ph, 3-F-6-Cl-Ph, 3-F-6-Me-Ph, 3-F-6-MeO-Ph, 4-F-2-Cl-Ph, 4-F-2-Me-Ph, 4-F-2-MeO-Ph, 4-F-3-Cl-Ph, 4-F-3-Me-Ph, 4-F-3-MeO-Ph, 2,4,6-F₃-Ph, 2-OH-Ph, 4-I-Ph, 4-MeOC(0)-Ph, 4-MeNHC(0)-Ph, 2,6-Me₂-Ph, 3-CF₃-Ph, 2-Br-Ph, 3-Br-Ph, 2-MeC(0)-Ph, 2-I-Ph, 3-I-Ph, 4-c-Pr-Ph, 4-(2-Cl-c-Pr)-Ph, 4-(2,2-Cl₂-c-Pr)-Ph, 4-(Ph-CH=CH)-Ph, 4-(Ph-C \equiv C)-Ph

h、4-PhS-Ph、4-HO-Ph、4-EtO-Ph、4-PenO-Ph、2-F-3-CF₃-Ph、2,3-Me₂-Ph、3,4-Me₂-Ph、3,5-Me₂-Ph、2,3-(MeO)₂-Ph、2,4-(MeO)₂-Ph、2,5-(MeO)₂-Ph、3,5-(MeO)₂-Ph、2-F-3-I-Ph、2-F-4-I-Ph、2-F-5-I-Ph、2-F-6-I-Ph、2-F-4-EtO-Ph、2-F-4-PrO-Ph、2-F-4-i-PrO-Ph、2-F-4-BuO-Ph、2-F-4-s-BuO-Ph、2-F-4-i-BuO-Ph、2-F-4-t-BuO-Ph、2-F-4-PenO-Ph、2-F-4-(2-Me-BuO)-Ph、2-F-4-(2,2-Me₂-PrO)-Ph、2-F-4-HexO-Ph、2-F-4-(2-Et-Hex)O-Ph、2-F-4-Et-Ph、2-F-4-Pr-Ph、2-F-4-i-Pr-Ph、2-F-4-Bu-Ph、2-F-4-s-Bu-Ph、2-F-4-i-Bu-Ph、2-F-4-t-Bu-Ph、2-F-4-Pen-Ph、2-F-4-(2-Me-Bu)-Ph、2-F-4-(2,2-Me₂-Pr)-Ph、2-F-4-Hex-Ph、2-F-4-(2-Et-Hex)-Ph、2-F-6-PhS-Ph、2-F-6-Me₂N-Ph、2-F-6-MeNH-Ph、2-F-6-Ph-Ph、3,4-methylenedioxy-Ph、3,4-ethylenedioxy-Ph、2-F-3-Br-Ph、2-F-4-Br-Ph、2-F-5-Br-Ph、2-F-6-Br-Ph、3-F-2-Br-Ph、3-F-4-Br-Ph、3-F-5-Br-Ph、3-F-6-Br-Ph、4-F-2-Br-Ph、4-F-3-Br-Ph、2-Cl-3-Me-Ph、2-Cl-4-Me-Ph、2-Cl-5-Me-Ph、2-Cl-6-Me-Ph、3-Cl-2-Me-Ph、3-Cl-4-Me-Ph、3-Cl-5-Me-Ph、3-Cl-6-Me-Ph、4-Cl-2-Me-Ph、4-Cl-3-Me-Ph、2,3-F₂-4-Me-Ph、2,3-F₂-5-Me-Ph、2,3-F₂-6-Me-Ph、2,4-F₂-3-Me-Ph、2,4-F₂-5-Me-Ph、2,4-F₂-6-Me-Ph、2,5-F₂-3-Me-Ph、2,5-F₂-4-Me-Ph、2,5-F₂-6-Me-Ph、2,6-F₂-3-Me-Ph、2,6-F₂-4-Me-Ph、2,3-F₂-4-Cl-Ph、2,3-F₂-5-Cl-Ph、2,3-F₂-6-Cl-Ph、2,4-F₂-3-Cl-Ph、2,4-F₂-5-Cl-Ph、2,4-F₂-6-Cl-Ph、2,5-F₂-3-Cl-Ph、2,6-F₂-4-Cl-Ph、2,3-F₂-4-MeO-Ph、2,3-F₂-5-MeO-Ph、2,3-F₂-6-MeO-Ph、2,4-F₂-3-MeO-Ph、2,4-F₂-5-MeO-Ph、2,4-F₂-6-MeO-Ph、2,5-F₂-3-MeO-Ph、2,5-F₂-4-MeO-Ph、2,5-F₂-6-MeO-Ph、2,6-F₂-3-MeO-Ph、2,6-F₂-4-MeO-Ph、2,3-F₂-4-EtO-Ph、2,3-F₂-5-EtO-Ph、2,3-F₂-6-EtO-Ph、2,4-F₂-3-EtO-Ph、2,4-F₂-5-EtO-Ph、2,4-F₂-6-EtO-Ph、2,5-F₂-4-EtO-Ph、2,5-F₂-6-EtO-Ph、2,6-F₂-3-EtO-Ph、2,6-F₂-4-EtO-Ph、2,3-F₂-4-Et-Ph、2,3-F₂-5-Et-Ph、2,3-F₂-6-Et-Ph、2,4-F₂-3-Et-Ph、2,4-F₂-5-Et-Ph、2,4-F₂-6-Et-Ph、2,5-F₂-3-Et-Ph、2,5-F₂-4-Et-Ph、2,5-F₂-6-Et-Ph、2,6-F₂-3-Et-Ph、2,6-F₂-4-Et-Ph、2,3-F₂-4-Br-Ph、2,3-F₂-5-Br-Ph、2,3-F₂-6-Br-Ph、2,4-F₂-3-Br-Ph、2,4-F₂-5-Br-Ph、2,4-F₂-6-Br-Ph、2,5-F₂-3-Br-Ph、2,5-F₂-4-Br-Ph、2,5-F₂-6-Br-Ph、2,6-F₂-3-Br-Ph、2,6-F₂-4-Br-Ph、2,6-F₂-4-Pr-Ph、2,6-F₂-4-i-Pr-Ph、2,6-F₂-4-

c-Pr-Ph、2,6-F₂-4-Bu-Ph、2,6-F₂-4-i-Bu-Ph、2,6-F₂-4-s-Bu-Ph、2,6-F₂-4-t-Bu-Ph、2,6-F₂-4-Pen-Ph、2,6-F₂-4-Hex-Ph、2,6-F₂-4-Ph-Ph、2,6-F₂-4-PhCH₂-Ph、2,6-F₂-4-PrO-Ph、2,6-F₂-4-i-PrO-Ph、2,6-F₂-4-c-PrO-Ph、2,6-F₂-4-BuO-Ph、2,6-F₂-4-i-BuO-Ph、2,6-F₂-4-s-BuO-Ph、2,6-F₂-4-t-BuO-Ph、2,6-F₂-4-PeNO-Ph、2,6-F₂-4-HexO-Ph、2,6-F₂-4-PhO-Ph、2,6-F₂-4-PhCH₂O-Ph、2-F-6-Cl-3-MeO-Ph、2-F-6-Cl-4-MeO-Ph、2-F-6-Cl-5-MeO-Ph、2-F-6-Cl-3-Me-Ph、2-F-6-C1-4-Me-Ph、2-F-6-C1-5-Me-Ph、2-F-6-MeO-3-Cl-Ph、2-F-6-MeO-4-Cl-Ph、2-F-6-MeO-5-Cl-Ph、2-F-6-MeO-3-Me-Ph、2-F-6-MeO-4-Me-Ph、2-F-6-MeO-5-Me-Ph、2,4,6-Me₃-Ph、2-C1-3-MeO-Ph、2-C1-4-MeO-Ph、2-C1-5-MeO-Ph、2-C1-6-MeO-Ph、3-C1-2-MeO-Ph、3-C1-4-MeO-Ph、3-C1-5-MeO-Ph、3-C1-6-MeO-Ph、4-C1-2-MeO-Ph、4-C1-3-MeO-Ph、2-Me-3-MeO-Ph、2-Me-4-MeO-Ph、2-Me-5-MeO-Ph、2-Me-6-MeO-Ph、3-Me-2-MeO-Ph、3-Me-4-MeO-Ph、3-Me-5-MeO-Ph、3-Me-6-MeO-Ph、4-Me-3-MeO-Phおよび2,6-(MeO)₂-Ph等があげられる。

R⁵、R⁶、R⁷、R^bおよびR^cにおける、R^aで置換されていてもよいヘテロアリール、R^aで置換されていてもよいヘテロアリールスルホニル、R^aで置換されていてもよいヘテロアリールカルボニルで定義される、R^aで置換されていてもよいヘテロアリールとしては、5-クロロチオフェン-2-イル、3,5-ジメチルフラン-2-イル、3-シアノピロール-1-イル、オキサゾール-2-イル、2-メチルスルフェニルオキサゾール-4-イル、4-メチルチアゾール-2-イル、2-トリフルオロメチルイミダゾール-1-イル、イソキサゾール-3-イル、3-クロロイソキサゾール-4-イル、3-メチルイソチアゾール-5-イル、3-フェニルピラゾール-1-イル、1-メチルピラゾール-5-イル、2-メチルスルホニル-1,3,4-オキサジアゾール-5-イル、2-ブロモ-1,3,4-チアジアゾール-2-イル、1,2,4-オキサジアゾール-3-イル、1,2,4-チアジアゾール-5-イル、1,2,4-トリアゾール-1-イル、1,2,3-チアジアゾール-5-イル、1,2,3-トリアゾール-1-イル、1,2,3,4-テトラゾール-1-イル、6-フェノキシピリジン-2-イル、6-メトキシピリミジン-2-イル、ピラジン-2-イル、ピリダジン-3-イル、1,3,5-トリアジン-2-イルおよび1,2,4-トリアジン-6-イル等が挙げられる。

R⁵、R⁶、R⁷、R^b、R^cおよびXにおける、R^aで置換されていてもよいフェ

ニルスルホニルおよびR^aで置換されていてもよいフェニルカルボニルで定義される、R^aで置換されていてもよいフェニルとしては、フェニル、2-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル、4-フルオロフェニル、2-クロロフェニル、3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、2-プロモフェニル、3-プロモフェニル、4-プロモフェニル、4-ヨードフェニル、2,4-ジクロロフェニル、3,4-ジクロロフェニル、2,6-ジフルオロフェニル、2,6-ジクロロフェニル、2-フルオロ-4-クロロフェニル、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル、2-メチルフェニル、3-メチルフェニル、4-メチルフェニル、2,5-ジメチルフェニル、4-メチル-2,3,5,6-テトラフルオロフェニル、2-メトキシフェニル、3-メトキシフェニル、4-メトキシフェニル、2,6-ジメトキシフェニル、3,4-ジメトキシフェニル、3,4,5-トリメトキシフェニル、2-トリフルオロメチルフェニル、3-トリフルオロメチルフェニルおよび4-トリフルオロメチルフェニル等があげられる。

R^b、R^c、R^d、R^eおよびR^fにおける、R^aで置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルスルホニルおよびR^aで置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルカルボニルで定義される、R^aで置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルとしては、ベンジル、2-クロロベンジル、3-プロモベンジル、4-クロロベンジル、4-メチルベンジル、4-t-ブチルベンジル、2-メチルベンジル、2-メトキシベンジル、1-フェニルエチル、1-(3-クロロフェニル)エチル、2-フェニルエチル、1-メチル-1-フェニルエチル、1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-フェニルプロピル、2-フェニルプロピル、3-フェニルプロピル、1-フェニルブチル、1-フェニルブチル、2-フェニルブチル、3-フェニルブチル、4-フェニルブチル、4-フェニルブチル、1-メチル-1-フェニルプロピル、1-メチル-2-フェニルプロピル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルプロピル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)プロピル、1-フェニルペンチル、2-フェニルペンチル、3-フェニルペンチル、4-フェニルペンチル、5-フェニルペンチル、1-メチル-1-フェニルブチル、1-メチル-2-フェニルブチル、1-メチル-3-フェニルブチル、1-メチル-4-フェニルブチル、2-メチル-2-フェニルブチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルブチル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ブチル、1-フェニルヘキシル、2-フェニル

ヘキシル、3-フェニルヘキシル、4-フェニルヘキシル、5-フェニルヘキシル、6-フェニルヘキシル、1-メチル-1-フェニルペンチル、1-メチル-2-フェニルペンチル、1-メチル-3-フェニルペンチル、1-メチル-4-フェニルペンチル、2-メチル-2-フェニルペンチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルペンチルおよび2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ペンチル等があげられる。

R⁷、R⁸およびR⁹における、R^aで置換されていてもよいフェノキシおよびR^bで置換されていてもよいフェノキシカルボニルにより定義される、R^cで置換されていてもよいフェノキシとしては、フェノキシ、2-フルオロフェノキシ、3-フルオロフェノキシ、4-フルオロフェノキシ、2-クロロフェノキシ、3-クロロフェノキシ、4-クロロフェノキシ、2-プロモフェノキシ、3-プロモフェノキシ、4-ブロモフェノキシ、4-ヨードフェノキシ、2,4-ジクロロフェノキシ、3,4-ジクロロフェノキシ、2,6-ジフルオロフェノキシ、2,6-ジクロロフェノキシ、2-フルオロ-4-クロロフェノキシ、2,3,4,5,6-ペントフルオロフェノキシ、2-メチルフェノキシ、3-メチルフェノキシ、4-メチルフェノキシ、2,5-ジメチルフェノキシ、4-メチル-2,3,5,6-テトラフルオロフェノキシ、2-メトキシフェノキシ、3-メトキシフェノキシ、4-メトキシフェノキシ、2,6-ジメトキシフェノキシ、3,4-ジメトキシフェノキシ、3,4,5-トリメトキシフェノキシ、2-トリフルオロメチルフェノキシ、3-トリフルオロメチルフェノキシおよび4-トリフルオロメチルフェノキシ等があげられる。

R⁷、R⁸およびR⁹の定義における、R^aで置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルコキシとしては、直鎖または分岐状のフェニルアルコキシとしてベンジルオキシ、2-クロロベンジルオキシ、3-プロモベンジルオキシ、4-クロロベンジルオキシ、4-メチルベンジルオキシ、4-t-ブチルベンジルオキシ、2-メチルベンジルオキシ、2-メトキシベンジルオキシ、1-フェニルエチルオキシ、1-(3-クロロフェニル)エチルオキシ、2-フェニルエチルオキシ、1-メチル-1-フェニルエチルオキシ、1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチルオキシ、1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチルオキシ、1-フェニルプロピルオキシ、2-フェニルプロピルオキシ、3-フェニルプロピルオキシ、1-フェニルブチルオキシ、2-フェニルブチルオキシ、3-フェニルブチルオキシ、4-フェニルブチルオキシ、1-メチ

ル-1-フェニルプロピルオキシ、1-メチル-2-フェニルプロピルオキシ、1-メチル-3-フェニルプロピルオキシ、2-メチル-2-フェニルプロピルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチル-プロピルオキシ、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)プロピルオキシ、1-フェニルペンチルオキシ、2-フェニルペンチルオキシ、3-フェニルペンチルオキシ、4-フェニルペンチルオキシ、5-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-1-フェニルブチルオキシ、1-メチル-2-フェニルブチルオキシ、1-メチル-3-フェニルブチルオキシ、1-メチル-4-フェニルブチルオキシ、2-メチル-2-フェニルブチルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルブチルオキシ、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ブチルオキシ、1-フェニルヘキシルオキシ、2-フェニルヘキシルオキシ、3-フェニルヘキシルオキシ、4-フェニルヘキシルオキシ、5-フェニルヘキシルオキシ、6-フェニルヘキシルオキシ、1-メチル-1-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-2-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-3-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-4-フェニルペンチルオキシ、2-メチル-2-フェニルペンチルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルペンチルオキシおよび2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ペンチルオキシ等があげられる。

R^a、R^bおよびR^cにおける、R^aで置換されていてもよいヘテロアリールオキシおよびR^cで置換されていてもよいヘテロアリールオキシカルボニルで定義される、R^aで置換されていてもよいヘテロアリールオキシとしては、5-クロロチオフェン-2-イルオキシ、3,5-ジメチルフラン-2-イルオキシ、3-シアノ-ピロール-1-イルオキシ、オキサゾール-2-イルオキシ、2-メチルスルフェニルオキサゾール-4-イルオキシ、4-メチルチアゾール-2-イルオキシ、2-トリフルオロメチルイミダゾール-4-イルオキシ、イソキサゾール-3-イルオキシ、3-クロロイソキサゾール-4-イルオキシ、3-メチルイソチアゾール-5-イルオキシ、1-ベンジル-3-フェニルピラゾール-5-イルオキシ、1-メチルピラゾール-5-イルオキシ、2-メチルスルホニル-1,3,4-オキサジアゾール-5-イルオキシ、2-プロモ-1,3,4-チアジアゾール-2-イルオキシ、1,2,4-オキサジアゾール-3-イルオキシ、1,2,4-チアジアゾール-5-イルオキシ、1,2,4-トリアゾール-3-イルオキシ、1,2,3-チアジアゾール-5-イルオキシ、1,2,3-トリアゾール-5-イルオキシ、1,2,3,4-テトラゾール-5-イルオキシ、6-フェノキシピリジン-2-イルオキシ、6-メトキシピリミジン-2

-イルオキシ、ピラジン-2-イルオキシ、ピリダジン-3-イルオキシ、1,3,5-トリアジン-2-イルオキシおよび1,2,4-トリアジン-6-イルオキシ等が挙げられる。

R^aにおける、R^aで置換されていてもよいフェニルスルフェニル、R^aで置換されていてもよいフェニルスルフィニルおよびR^aで置換されていてもよいフェニルカルボニルオキシで定義される、R^aで置換されていてもよいフェニルとしては、フェニル、2-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル、4-フルオロフェニル、2-クロロフェニル、3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、2-プロモフェニル、3-プロモフェニル、4-プロモフェニル、4-ヨードフェニル、2,4-ジクロロフェニル、3,4-ジクロロフェニル、2,6-ジフルオロフェニル、2,6-ジクロロフェニル、2-フルオロ-4-クロロフェニル、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル、2-メチルフェニル、3-メチルフェニル、4-メチルフェニル、2,5-ジメチルフェニル、4-メチル-2,3,5,6-テトラフルオロフェニル、2-メトキシフェニル、3-メトキシフェニル、4-メトキシフェニル、2,6-ジメトキシフェニル、3,4-ジメトキシフェニル、3,4,5-トリメトキシフェニル、2-トリフルオロメチルフェニル、3-トリフルオロメチルフェニルおよび4-トリフルオロメチルフェニル等があげられる。

R^aにおける、R^aで置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルスルフェニル、R^aで置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルスルフィニルおよびR^aで置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルカルボニルオキシで定義されるR^aで置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルとしては、直鎖または分岐状のフェニルアルキルとしてベンジル、2-クロロベンジル、3-プロモベンジル、4-クロロベンジル、4-メチルベンジル、4-t-ブチルベンジル、2-メチルベンジル、2-メトキシベンジル、1-フェニルエチル、1-(3-クロロフェニル)エチル、2-フェニルエチル、1-メチル-1-フェニルエチル、1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-フェニルプロピル、2-フェニルプロピル、3-フェニルプロピル、1-フェニルブチル、2-フェニルブチル、3-フェニルブチル、4-フェニルブチル、1-メチル-1-フェニルプロピル、1-メチル-2-フェニルプロピル、1-メチル-3-フェニルプロピル、2-メチル-2-フェニルプロピル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルプロピル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)プロピル、1-フェニルペンチル、2-フェニルペンチル

、3-フェニルペンチル、4-フェニルペンチル、5-フェニルペンチル、1-メチル-1-フェニルブチル、1-メチル-2-フェニルブチル、1-メチル-3-フェニルブチル、1-メチル-4-フェニルブチル、2-メチル-2-フェニルブチル、2-（4-クロロフェニル）-2-メチルブチル、2-メチル-2-（3-メチルフェニル）ブチル、1-フェニルヘキシル、2-フェニルヘキシル、3-フェニルヘキシル、4-フェニルヘキシル、5-フェニルヘキシル、6-フェニルヘキシル、1-メチル-1-フェニルペンチル、1-メチル-2-フェニルペンチル、1-メチル-3-フェニルペンチル、1-メチル-4-フェニルペンチル、2-メチル-2-フェニルペンチル、2-（4-クロロフェニル）-2-メチルベンチルおよび2-メチル-2-（3-メチルフェニル）ベンチル等があげられる。

R°における、R°で置換されていてもよいヘテロアリールスルフィニル、R°で置換されていてもよいヘテロアリールスルフェニルおよびR°で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニルオキシで定義されるR°で置換されていてもよいヘテロアリールとしては、5-クロロチオフェン-2-イル、3,5-ジメチルフラン-2-イル、3-シアノピロール-1-イル、オキサゾール-2-イル、2-メチルスルフェニルオキサゾール-4-イル、4-メチルチアゾール-2-イル、2-トリフルオロメチルイミダゾール-1-イル、イソキサゾール-3-イル、3-クロロイソキサゾール-4-イル、3-メチルイソチアゾール-5-イル、3-フェニルピラゾール-1-イル、1-メチルピラゾール-5-イル、2-メチルスルホニル-1,3,4-オキサジアゾール-5-イル、2-プロモ-1,3,4-チアジアゾール-2-イル、1,2,4-オキサジアゾール-3-イル、1,2,4-チアジアゾール-5-イル、1,2,4-トリアゾール-1-イル、1,2,3-チアジアゾール-5-イル、1,2,3-トリアゾール-1-イル、1,2,3,4-テトラゾール-1-イル、6-フェノキシピリジン-2-イル、6-メトキシピリミジン-2-イル、ピラジン-2-イル、ピリダジン-3-イル、1,3,5-トリアジン-2-イルおよび1,2,4-トリアジン-6-イル等が挙げられる。

R°の定義におけるR°で置換されていてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルコキシとしては、直鎖または分岐状のヘテロアリールアルコキシとしてピリジン-2-イルメチルオキシ、5-クロロチオフェン-2-イルメチルオキシ、1-メチル-3-クロロピラゾール-5-イルメチルオキシ、2-（3-メチルフラン-2-イル）エチルオキシ、3-（6-トリフルオロメチルピリジン-2-イル）プロピルオキシ、4-（ピリミ

ジン-2-イル) ブチルオキシ、5-(トリアゾール-1-イル) ペンチルオキシおよび6-(ピロール-1-イル) ヘキシリオキシ等が挙げられる。

R° における、 R° で置換されていてもよいヘテロアリール $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフェニル、 R° で置換されていてもよいヘテロアリール $C_1 \sim C_6$ アルキルスルフィニル、 R° で置換されていてもよいヘテロアリール $C_1 \sim C_6$ アルキルスルホニル、 R° で置換されていてもよいヘテロアリール $C_1 \sim C_6$ アルキルカルボニルオキシで定義される、 R° で置換されていてもよいヘテロアリール $C_1 \sim C_6$ アルキルとしては、直鎖または分岐状のヘテロアリールアルキルとしてピリジン-2-イルメチル、5-クロロチオフェン-2-イルメチル、1-メチル-3-クロロピラゾール-5-イルメチル、2-(3-メチルフラン-2-イル) エチル、3-(6-トリフルオロメチルピリジン-2-イル) プロピル、4-(ピリミジン-2-イル) ブチル、5-(トリアゾール-1-イル) ペンチルおよび6-(ピロール-1-イル) ヘキシリ等が挙げられる。

Y' における、 R° で置換されていてもよいフェニル、 R° で置換されていてもよいフェニルスルフェニル、 R° で置換されていてもよいフェニルスルフィニル、 R° で置換されていてもよいフェニルスルホニル、 R° で置換されていてもよいフェニルカルボニルおよび R° で置換されていてもよいフェニルカルボニルオキシで定義される R° で置換されていてもよいフェニルとしては、Ph、2-Cl-Ph、3-Cl-Ph、4-Cl-Ph、2-F-Ph、3-F-Ph、4-F-Ph、2-Me-Ph、3-Me-Ph、4-Me-Ph、2-MeO-Ph、3-MeO-Ph、4-MeO-Ph、4-Br-Ph、2,4-Cl₂-Ph、3,4-Cl₂-Ph、2,4,6-Cl₃-Ph、3,4-(MeO)₂-Ph、2-Cl-4-Me-Ph、2-MeO-4-Me-Ph、2-Cl-4-i-PrO-Ph、3-Cl-4-PhCH₂-Ph、2,4-Me₂-Ph、2,5-Me₂-Ph、2,6-F₂-Ph、2,3,4,5,6-F₅-Ph、4-Et-Ph、4-i-Pr-Ph、4-n-Bu-Ph、4-s-Bu-Ph、4-t-Bu-Ph、4-(t-BuCH₂)-Ph、4-Et(Me)₂C-Ph、4-n-Hex-Ph、4-((Me)₂(CN)C)-Ph、4-PhCH₂-Ph、4-(4-F-Ph)(Me)₂C-Ph、4-(MeCH=C=H)-Ph、4-(MeC≡C)-Ph、4-CF₃-Ph、4-CF₃CH₂-Ph、4-(Cl₂C=CHCH₂)-Ph、4-(BrC≡C)-Ph、4-(2,2-F₂-c-BuCH₂)-Ph、4-(1-Me-c-Pr)-Ph、4-i-PrO-Ph、4-t-BuO-Ph、4-n-HexO-Ph、4-MeCC(O)Ph、4-(CH₂=CHCH₂O)-Ph、4-CHF₂O-Ph、4-CBrF₂O-Ph、4-CF₃O-Ph、4-CF₃CH₂O-Ph、4-(CF₂=CHCH₂CH₂O)-Ph、4-CCl₃CCH₂O-Ph、4-MeS-Ph、4-s-BuS-Ph、4-EtSO-Ph、4-MeSO₂-Ph、4-EtSO₂-Ph、4-i-PrSO₂-Ph、4-t-BuSO₂-Ph、4-(MeCH=CHCH₂S)-Ph、4-(CH₂=CHCH₂SO)-Ph、4-(ClCH=CHCH₂SO₂)-Ph、4-(HC≡

CCH₂S)-Ph, 4-(HC≡CCH₂SO-Ph), 4-(HC≡CCH₂SO₂)-Ph, 4-CHF₂S-Ph, 4-CBrF₂S-P
h, 4-CF₃S-Ph, 4-CF₃CH₂S-Ph, 4-CHF₂CF₂S-Ph, 4-CHF₂SO-Ph, 4-CBrF₂SO-Ph, 4-
CF₃SO-Ph, 4-CF₃CH₂SO₂-Ph, 4-CHF₂CF₂SO₂-Ph, 4-CHF₂SO₂-Ph, 4-CBrF₂SO₂-Ph,
4-CF₃SO₂-Ph, 4-(Cl₂C=CHCH₂S)-Ph, 4-(Cl₂C=CHCH₂SO)-Ph, 4-(Cl₂C=CHCH₂SO₂)-
Ph, 4-(BrC≡CCH₂S)-Ph, 4-(BrC≡CCH₂SO)-Ph, 4-(BrC≡CCH₂SO₂)-Ph, 4-CHO-Ph
, 4-NO₂-Ph, 3-CN-Ph, 4-CN-Ph, 4-(Me)₂N-Ph, 4-Me(MeC(0))N-Ph, 4-PhMeN-Ph
, 4-PhCH₂(MeC(0))N-Ph, 4-PhCH₂O-Ph, 4-(2-Cl-Ph)CH₂O-Ph, 4-(3-Cl-Ph)CH₂O-
Ph, 4-(4-Cl-Ph)CH₂O-Ph, 4-(2-Me-Ph)CH₂O-Ph, 4-(3-Me-Ph)CH₂O-Ph, 4-(4-F-P
h)CH₂O-Ph, 4-(4-Et-Ph)CH₂O-Ph, 4-(2-Cl-Ph)CH₂S-Ph, 4-(3-Cl-Ph)CH₂S-Ph, 4
-(4-Cl-Ph)CH₂SO-Ph, 4-(2-Me-Ph)CH₂S-Ph, 4-(3-Me-Ph)CH₂SO₂-Ph, 4-(2,4-F₂-
Ph)CH₂O-Ph, 3-(3,4-Cl₂-Ph)CH₂O-Ph, 4-(2,5-Me₂-Ph)CH₂O-Ph, 4-(2,3,5,6-F₄-
Ph)CH₂O-Ph, 4-MeC(0)-Ph, 4-EtC(0)-Ph, 4-n-PrC(0)-Ph, 4-i-PrC(0)-Ph, 4-i-
BuC(0)-Ph, 4-t-BuC(0)-Ph, 4-i-BuCH₂C(0)-Ph, 4-Et(Me)₂CC(0)-Ph, 4-n-HexC(0)-
Ph, 4-PhC(0)-Ph, 4-(2-Cl-Ph)C(0)-Ph, 4-(3-Br-Ph)C(0)-Ph, 4-(4-Cl-Ph)C
(0)-Ph, 4-(2-Me-Ph)C(0)-Ph, 4-MeOCH₂-Ph, 4-EtOCH₂-Ph, 4-i-PrOCH₂-Ph, 4-M
eSCH₂-Ph, 4-EtSCH₂-Ph, 4-i-PrSCH₂-Ph, 4-CF₃C(0)-Ph, 4-CF₃CF₂C(0)-Ph, 4-M
eC(0)O-Ph, 4-EtC(0)O-Ph, 4-n-PrC(0)O-Ph, 4-i-PrC(0)O-Ph, 4-i-BuC(0)O-Ph
, 4-t-BuC(0)O-Ph, 4-i-BuCH₂C(0)O-Ph, 4-Et(Me)₂CC(0)O-Ph, 4-n-HexC(0)O-Ph
, 4-CF₃C(0)O-Ph, 4-CF₃CF₂C(0)O-Ph, 4-PhC(0)O-Ph, 3-Ph-Ph, 4-Ph-Ph, 4-(4-
Cl-Ph)-Ph, 4-(2,5-Me₂-Ph)-3-Me-Ph, 3-PhO-Ph, 4-PhO-Ph, 4-(4-Cl-Ph)O-Ph, 4
-(4-Me-Ph)O-Ph, 4-(4-F-Ph)O-Ph, 4-(4-MeO-Ph)O-Ph, 4-(2,4-Cl₂-Ph)O-Ph, 4
-(3,4-Cl₂-Ph)O-Ph, 4-(2-Pyridyl)-Ph, 4-(5-Cl-2-Pyridyl)-Ph, 2,3-Cl₂-Ph,
3,5-Cl₂-Ph, 2,6-Cl₂-Ph, 2,5-Cl₂-Ph, 2,3-F₂-Ph, 2,5-F₂-Ph, 3,4-F₂-Ph, 3,5
-F₂-Ph, 2,4-F₂-Ph, 2-CF₃-Ph, 3-(3-Cl-PhCH₂O)-Ph, 2-F-6-CF₃-Ph, 2-F-6-C1-
Ph, 2-F-6-Me-Ph, 2-F-6-MeO-Ph, 2-F-6-OH-Ph, 2-F-6-MeS-Ph, 2-F-5-Cl-Ph, 2
-F-5-CF₃-Ph, 2-F-5-Me-Ph, 2-F-5-MeO-Ph, 2-F-5-OH-Ph, 2-F-5-MeS-Ph, 2-F-4
-Cl-Ph, 2-F-4-CF₃-Ph, 2-F-4-Me-Ph, 2-F-4-MeO-Ph, 2-F-3-Cl-Ph, 2-F-3-Me-P
h, 2-F-3-MeO-Ph, 3-F-2-Cl-Ph, 3-F-2-Me-Ph, 3-F-2-MeO-Ph, 3-F-4-Cl-Ph, 3-
F-4-Me-Ph, 3-F-4-MeO-Ph, 3-F-5-Cl-Ph, 3-F-5-Me-Ph, 3-F-5-MeO-Ph, 3-F-6-C

1-Ph, 3-F-6-Me-Ph, 3-F-6-MeO-Ph, 4-F-2-Cl-Ph, 4-F-2-Me-Ph, 4-F-2-MeO-Ph, 4-F-3-Cl-Ph, 4-F-3-Me-Ph, 4-F-3-MeO-Ph, 2, 4, 6-F₃-Ph, 2-OH-Ph, 4-I-Ph, 4-MeOC(0)-Ph, 4-MeNHCO-Ph, 2, 6-Me₂-Ph, 2, 6-(MeO)₂-Ph, 4-(6-F-5-CF₃-2-Pyridyl)-Ph, 4-(2-Pyridyl)O-Ph, 4-(5-Cl-2-Pyridyl)O-Ph, 4-(3-Cl-5-F-2-Pyridyl)O-Ph, 4-(5-Cl-2-Thienyl)O-Ph, 3-CF₃-Ph, 2-Br-Ph, 3-Br-Ph, 2-MeC(0)-Ph, 2-I-Ph, 3-I-Ph, 4-c-Pr-Ph, 4-(2-Cl-c-Pr)-Ph, 4-(2, 2-Cl₂-c-Pr)-Ph, 4-(Ph-CH=CH)-Ph, 4-(Ph-C≡C)-Ph, 4-PhS-Ph, 4-HO-Ph, 4-EtO-Ph, 4-PenO-Ph, 2-F-3-CF₃-Ph, 2, 3-Me₂-Ph, 3, 4-Me₂-Ph, 3, 5-Me₂-Ph, 2, 3-(MeO)₂-Ph, 2, 4-(MeO)₂-Ph, 2, 5-(MeO)₂-Ph, 3, 5-(MeO)₂-Ph, 2-F-3-I-Ph, 2-F-4-I-Ph, 2-F-5-I-Ph, 2-F-6-I-Ph, 2-F-4-EtO-Ph, 2-F-4-PrO-Ph, 2-F-4-i-PrO-Ph, 2-F-4-BuO-Ph, 2-F-4-s-BuO-Ph, 2-F-4-i-BuO-Ph, 2-F-4-t-BuO-Ph, 2-F-4-PenO-Ph, 2-F-4-(2-Me-BuO)-Ph, 2-F-4-(2, 2-Me₂-PrO)-Ph, 2-F-4-HexO-Ph, 2-F-4-(2-Et-Hex)O-Ph, 2-F-4-Et-Ph, 2-F-4-Pr-Ph, 2-F-4-i-Pr-Ph, 2-F-4-Bu-Ph, 2-F-4-s-Bu-Ph, 2-F-4-i-Bu-Ph, 2-F-4-t-Bu-Ph, 2-F-4-Pen-Ph, 2-F-4-(2-Me-Bu)-Ph, 2-F-4-(2, 2-Me₂-Pr)-Ph, 2-F-4-Hex-Ph, 2-F-4-(2-Et-Hex)-Ph, 2-F-6-PhS-Ph, 2-F-6-Me₂N-Ph, 2-F-6-MeNH-Ph, 2-F-6-Ph-Ph, 3, 4-methylenedioxy-Ph, 3, 4-ethylenedioxy-Ph, 2-F-3-Br-Ph, 2-F-4-Br-Ph, 2-F-5-Br-Ph, 2-F-6-Br-Ph, 3-F-2-Br-Ph, 3-F-4-Br-Ph, 3-F-5-Br-Ph, 3-F-6-Br-Ph, 4-F-2-Br-Ph, 4-F-3-Br-Ph, 2-Cl-3-Me-Ph, 2-Cl-4-Me-Ph, 2-Cl-5-Me-Ph, 2-Cl-6-Me-Ph, 3-Cl-2-Me-Ph, 3-Cl-4-Me-Ph, 3-Cl-5-Me-Ph, 3-Cl-6-Me-Ph, 4-Cl-2-Me-Ph, 4-Cl-3-Me-Ph, 2, 3-F₂-4-Me-Ph, 2, 3-F₂-5-Me-Ph, 2, 3-F₂-6-Me-Ph, 2, 4-F₂-3-Me-Ph, 2, 4-F₂-5-Me-Ph, 2, 4-F₂-6-Me-Ph, 2, 5-F₂-3-Me-Ph, 2, 6-F₂-3-Me-Ph, 2, 6-F₂-4-Me-Ph, 2, 3-F₂-4-Cl-Ph, 2, 3-F₂-5-Cl-Ph, 2, 3-F₂-6-Cl-Ph, 2, 4-F₂-3-Cl-Ph, 2, 4-F₂-5-Cl-Ph, 2, 5-F₂-3-Cl-Ph, 2, 5-F₂-4-Cl-Ph, 2, 5-F₂-6-Cl-Ph, 2, 6-F₂-3-Cl-Ph, 2, 6-F₂-4-Cl-Ph, 2, 3-F₂-4-MeO-Ph, 2, 3-F₂-5-MeO-Ph, 2, 4-F₂-3-MeO-Ph, 2, 4-F₂-5-MeO-Ph, 2, 4-F₂-6-MeO-Ph, 2, 5-F₂-3-MeO-Ph, 2, 5-F₂-4-MeO-Ph, 2, 5-F₂-6-MeO-Ph, 2, 6-F₂-3-MeO-Ph, 2, 6-F₂-4-MeO-Ph, 2, 3-F₂-4-EtO-Ph, 2, 3-F₂-5-EtO-Ph, 2, 3-F₂-6-EtO-Ph, 2, 4-F₂-3-EtO-Ph, 2, 4-F₂-5-EtO-Ph, 2, 4-F₂-6-EtO-Ph, 2, 5-F₂-3-EtO-Ph, 2, 5-

$F_2-4-Et0-Ph$, 2, 5- $F_2-6-Et0-Ph$, 2, 6- $F_2-3-Et0-Ph$, 2, 6- $F_2-4-Et0-Ph$, 2, 3- F_2-4 -
 $-Et-Ph$, 2, 3- $F_2-5-Et-Ph$, 2, 3- $F_2-6-Et-Ph$, 2, 4- $F_2-3-Et-Ph$, 2, 4- $F_2-5-Et-Ph$,
2, 4- $F_2-6-Et-Ph$, 2, 5- $F_2-3-Et-Ph$, 2, 5- $F_2-4-Et-Ph$, 2, 5- $F_2-6-Et-Ph$, 2, 6- F_2-3 -
 $-Et-Ph$, 2, 6- $F_2-4-Et-Ph$, 2, 3- $F_2-4-Br-Ph$, 2, 3- $F_2-5-Br-Ph$, 2, 3- $F_2-6-Br-Ph$,
2, 4- $F_2-3-Br-Ph$, 2, 4- $F_2-5-Br-Ph$, 2, 4- $F_2-6-Br-Ph$, 2, 5- $F_2-3-Br-Ph$, 2, 5- F_2-4 -
 $-Br-Ph$, 2, 5- $F_2-6-Br-Ph$, 2, 6- $F_2-3-Br-Ph$, 2, 6- $F_2-4-Br-Ph$, 2, 6- $F_2-4-i-Bu-Ph$, 2,
6- $F_2-4-s-Bu-Ph$, 2, 6- $F_2-4-c-Pt-Ph$, 2, 6- $F_2-4-Bu-Ph$, 2, 6- $F_2-4-Hex-Ph$, 2,
 $F_2-4-Ph-Ph$, 2, 6- $F_2-4-t-Bu-Ph$, 2, 6- $F_2-4-PeO-Ph$, 2, 6- $F_2-4-i-PtO-Ph$, 2, 6-
2- $F_2-4-c-PtO-Ph$, 2, 6- $F_2-4-BuO-Ph$, 2, 6- $F_2-4-i-BuO-Ph$, 2, 6- $F_2-4-s-BuO-Ph$, 2, 6-
6- $F_2-4-t-BuO-Ph$, 2, 6- $F_2-4-PeO-Ph$, 2, 6- $F_2-4-HexO-Ph$, 2, 6- $F_2-4-PhO-Ph$, 2, 6-
 $F_2-4-PhCH_2-Ph$, 2, 6- $F_2-4-BuO-Ph$, 2, 6- $F_2-4-i-BuO-Ph$, 2, 6- $F_2-4-s-BuO-Ph$, 2, 6-
2- $F_2-6-C1-3-MeO-Ph$, 2- $F_2-6-C1-3-MeO-Ph$, 2- $F_2-6-C1-4-MeO-Ph$, 2- $F_2-6-C1-5-MeO-Ph$
Me- Ph , 2- $F_2-6-MeO-4-C1-Ph$, 2- $F_2-6-MeO-5-C1-Ph$, 2- $F_2-6-MeO-3-Me-Ph$, 2- $F_2-6-MeO-4-$
Undec- Ph , 4-Dodec- Ph , 4-Hep- Ph , 4-Oct- Ph , 4-Non- Ph , 4-Dec- Ph , 4-Undec-
 Ph , 4-Dodec- Ph , 2- $C1-4-HepO-Ph$, 2- $C1-4-OctO-Ph$, 2- $C1-4-NonO-Ph$, 2- $C1-4-D$
 $-C1-4-Non-Ph$, 2- $C1-4-Dec-Ph$, 2- $C1-4-Undec-Ph$, 2- $C1-4-Dodec-Ph$, 3- $C1-4$ -
Hep- Ph , 3- $C1-4-OctO-Ph$, 3- $C1-4-NonO-Ph$, 3- $C1-4-DecO-Ph$, 3- $C1-4-Non-Ph$, 3- $C1-4$ -
4-Dec- Ph , 3- $C1-4-DodecO-Ph$, 3- $C1-4-Hep-Ph$, 3- $C1-4-Oct-Ph$, 3- $C1-4-Non-Ph$, 3-
2- $F_2-4-NonO-Ph$, 2- $F_2-4-DecO-Ph$, 2- $F_2-4-UndecO-Ph$, 2- $F_2-4-DodecO-Ph$, 2- F_2-4-
Dodec- Ph , 3- $F_2-4-HepO-Ph$, 3- $F_2-4-OctO-Ph$, 3- $F_2-4-NonO-Ph$, 3- $F_2-4-DecO-Ph$, 3-
F-4- $UndecO-Ph$, 3- $F_2-4-DodecO-Ph$, 3- $F_2-4-Hep-Ph$, 3- $F_2-4-Oct-Ph$, 3- $F_2-4-Non-Ph$,
2- $C1-3-MeO-Ph$, 2- $C1-4-MeO-Ph$, 2- $C1-5-MeO-Ph$, 2- $C1-6-MeO-Ph$, 3- $C1-2-MeO$ -
 Ph , 3- $C1-4-MeO-Ph$, 3- $C1-5-MeO-Ph$, 3- $C1-6-MeO-Ph$, 4- $C1-2-MeO-Ph$, 4- $C1-3-$
MeO- Ph , 2- $Me-3-MeO-Ph$, 2- $Me-4-MeO-Ph$, 2- $Me-5-MeO-Ph$, 2- $Me-6-MeO-Ph$, 3- Me

-2-MeO-Ph、3-Me-4-MeO-Ph、3-Me-5-MeO-Ph、3-Me-6-MeO-Ph、4-Me-3-MeO-Ph、3-F-4-Dec-Ph、3-F-4-Undec-Ph、3-F-4-Dodec-Phおよび2,4,6-Me₃-Ph等があげられる。

Y'における、R°で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキル、R°で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルスルフェニル、R°で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルスルフィニル、R°で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルスルホニル、R°で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルカルボニルおよびR°で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルカルボニルオキシで定義される、R°で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルとしては、直鎖または分岐状のフェニルアルキルとしてベンジル、2-クロロベンジル、3-プロモベンジル、4-クロロベンジル、4-メチルベンジル、4-t-ブチルベンジル、2-メチルベンジル、2-メトキシベンジル、1-フェニルエチル、1-(3-クロロフェニル)エチル、2-フェニルエチル、1-メチル-1-フェニルエチル、1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-フェニルプロピル、2-フェニルプロピル、3-フェニルプロピル、1-フェニルブチル、2-フェニルブチル、3-フェニルブチル、4-フェニルブチル、1-メチル-1-フェニルプロピル、1-メチル-2-フェニルプロピル、1-メチル-3-フェニルプロピル、2-メチル-2-フェニルプロピル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルプロピル、1-フェニルペンチル、2-フェニルペンチル、3-フェニルペンチル、4-フェニルペンチル、5-フェニルペンチル、1-メチル-1-フェニルブチル、1-メチル-2-フェニルブチル、1-メチル-3-フェニルブチル、1-メチル-4-フェニルブチル、2-メチル-2-フェニルブチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルブチル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ブチル、1-フェニルヘキシル、2-フェニルヘキシル、3-フェニルヘキシル、4-フェニルヘキシル、5-フェニルヘキシル、6-フェニルヘキシル、1-メチル-1-フェニルペンチル、1-メチル-2-フェニルペンチル、1-メチル-3-フェニルペンチル、1-メチル-4-フェニルペンチル、2-メチル-2-フェニルペンチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルペンチルおよび2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ペンチル等があげられる。

Y' の定義における、R°で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルコキシとしては、直鎖または分岐状のフェニルアルコキシとしてベンジルオキシ、2-クロロベンジルオキシ、3-プロモベンジルオキシ、4-クロロベンジルオキシ、4-メチルベンジルオキシ、4-t-ブチルベンジルオキシ、2-メチルベンジルオキシ、2-メトキシベンジルオキシ、1-フェニルエチルオキシ、1-(3-クロロフェニル)エチルオキシ、2-フェニルエチルオキシ、1-メチル-1-フェニルエチルオキシ、1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチルオキシ、1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチルオキシ、1-フェニルプロピルオキシ、2-フェニルプロピルオキシ、3-フェニルプロピルオキシ、1-フェニルブチルオキシ、2-フェニルブチルオキシ、3-フェニルブチルオキシ、4-フェニルブチルオキシ、1-メチル-1-フェニルプロピルオキシ、1-メチル-2-フェニルプロピルオキシ、1-メチル-3-フェニルプロピルオキシ、2-メチル-2-フェニルプロピルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルプロピルオキシ、2-メチル-2-フェニルペンチルオキシ、2-フェニルペンチルオキシ、3-フェニルペンチルオキシ、4-フェニルペンチルオキシ、5-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-1-フェニルブチルオキシ、1-メチル-2-フェニルブチルオキシ、1-メチル-3-フェニルブチルオキシ、1-メチル-4-フェニルブチルオキシ、2-メチル-2-フェニルブチルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルブチルオキシ、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ブチルオキシ、1-フェニルヘキシルオキシ、2-フェニルヘキシルオキシ、3-フェニルヘキシルオキシ、4-フェニルヘキシルオキシ、5-フェニルヘキシルオキシ、6-フェニルヘキシルオキシ、1-メチル-1-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-2-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-3-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-4-フェニルペンチルオキシ、2-メチル-2-フェニルペンチルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルペンチルオキシおよび2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ペンチルオキシ等があげられる。

Y' における、R°で置換されていてもよいフェノキシおよびR°で置換されていてもよいフェノキシカルボニルで定義される、R°で置換されていてもよいフェノキシとしては、フェノキシ、2-フルオロフェノキシ、3-フルオロフェノキシ、4-フルオロフェノキシ、2-クロロフェノキシ、3-クロロフェノキシ、4-クロロ

フェノキシ、2-プロモフェノキシ、3-プロモフェノキシ、4-プロモフェノキシ、4-ヨードフェノキシ、2,4-ジクロロフェノキシ、3,4-ジクロロフェノキシ、2,6-ジフルオロフェノキシ、2,6-ジクロロフェノキシ、2-フルオロ-4-クロロフェノキシ、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェノキシ、2-メチルフェノキシ、3-メチルフェノキシ、4-メチルフェノキシ、2,5-ジメチルフェノキシ、4-メチル-2,3,5,6-テトラフルオロフェノキシ、2-メトキシフェノキシ、3-メトキシフェノキシ、4-メトキシフェノキシ、2,6-ジメトキシフェノキシ、3,4-ジメトキシフェノキシ、3,4,5-トリメトキシフェノキシ、2-トリフルオロメチルフェノキシ、3-トリフルオロメチルフェノキシおよび4-トリフルオロメチルフェノキシ等があげられる。

Y'における、R°で置換されていてもよいヘテロアリール、R°で置換されていてもよいヘテロアリールスルフィニル、R°で置換されていてもよいヘテロアリールスルフェニル、R°で置換されていてもよいヘテロアリールスルホニル、R°で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニルおよびR°で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニルオキシで定義される、R°で置換されていてもよいヘテロアリールとしては、2-フルオロフラン-3-イル、3-シアノピロール-1-イル、オキサゾール-2-イル、2-メチルスルフェニルオキサゾール-4-イル、2-メチルスルホニル-1,3,4-オキサジアゾール-5-イル、2-プロモ-1,3,4-チアジアゾール-5-イル、1,2,4-オキサジアゾール-3-イル、1,2,4-チアジアゾール-5-イル、1,2,4-トリアゾール-1-イル、1,2,3-トリアゾール-1-イル、1,2,3,4-テトラゾール-1-イル、6-メトキシピリミジン-2-イル、ピリダジン-3-イル、1,3,5-トリアジン-2-イル、1,2,4-トリアジン-6-イル、1-メチルピラゾール-5-イル、1-メチルピラゾール-4-イル、1-メチルピラゾール-3-イル、1-フェニルピラゾール-5-イル、1-フェニルピラゾール-4-イル、1-フェニルピラゾール-3-イル、1-メチル-4-フルオロピラゾール-5-イル、1-メチル-4-フルオロピラゾール-3-イル、1-メチル-3-フルオロピラゾール-4-イル、1-メチル-3-フルオロピラゾール-5-イル、1-メチル-5-フルオロピラゾール-3-イル、1-メチル-5-フルオロピラゾール-4-イル、1-メチル-4-クロロピラゾール-5-イル、1-メチル-4-クロロピラゾール-3-イル、1-メチル-3-クロロピラゾール-5-イル、1-メチル-5-クロロピラゾール-3-イル、1-メチル-5-クロロピラゾール-

4-イル、1-メチル-3-プロモピラゾール-4-イル、1-メチル-3-フェニルピラゾール-4-イル、1-メチル-5-ニトロピラゾール-4-イル、1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-4-イル、1-メチル-3-ジフルオロクロロメチルピラゾール-4-イル、1-メチル-3-トリフルオロメチル-5-メトキシピラゾール-4-イル、1-メチル-5-トリフルオロメチルピラゾール-3-イル、1-メチル-4-メトキシカルボニルピラゾール-5-イル、1-メチル-4-メトキシカルボニルピラゾール-3-イル、1-メチル-5-メトキシカルボニルピラゾール-3-イル、1-メチル-3-クロロ-4-メトキシカルボニルピラゾール-5-イル、1-メチル-3-クロロ-4-エトキシカルボニルピラゾール-5-イル、1-メチル-4-エトキシカルボニルピラゾール-3-イル、1,4-ジメチルピラゾール-5-イル、1,4-ジメチルピラゾール-3-イル、1,3-ジメチルピラゾール-4-イル、1,3-ジメチルピラゾール-5-イル、1,5-ジメチルピラゾール-3-イル、1,5-ジメチルピラゾール-4-イル、1,3-ジメチル-5-クロロピラゾール-4-イル、1,3-ジメチル-5-フルオロピラゾール-4-イル、1,3-ジメチル-5-メトキシピラゾール-4-イル、1,3,5-トリメチルピラゾール-4-イル、1,3-ジメチル-4-クロロピラゾール-5-イル、1,3-ジメチル-4-フルオロピラゾール-5-イル、1,3-ジメチル-4-ニトロピラゾール-5-イル、1,3-ジメチル-4-メトキシピラゾール-5-イル、1-メチル-3,5-ジクロロピラゾール-4-イル、1-メチル-3,5-ジフルオロピラゾール-4-イル、1-フェニル-3,5-ジクロロピラゾール-4-イル、1-フェニル-3,5-ジフルオロピラゾール-4-イル、1-（2-ピリジル）-3,5-ジクロロピラゾール-4-イル、1-フェニル-5-メチルピラゾール-4-イル、1-フェニル-5-ジフルオロクロロメチルピラゾール-4-イル、1-t-ブチル-5-メチルピラゾール-4-イル、1-メチルピロール-2-イル、1-メチルピロール-3-イル、1-メチル-4-トリフルオロメチルピロール-5-イル、フラン-2-イル、フラン-3-イル、5-メチルフラン-2-イル、5-フェニルフラン-2-イル、2,5-ジメチルフラン-3-イル、2,4-ジメチルフラン-3-イル、チオフェン-2-イル、チオフェン-3-イル、5-フェニルチオフェン-2-イル、5-メチルチオフェン-2-イル、5-プロモチオフェン-2-イル、3-プロモチオフェン-2-イル、4,5-ジプロモチオフェン-2-イル、5-ヨードチオフェン-2-イル、5-クロロチオフ

エン-2-イル、5-フェニル-2-メチルチオフェン-3-イル、5-ニトロチオフェン-3-イル、3-メチルチオフェン-2-イル、3-クロロチオフェン-2-イル、3-メトキシチオフェン-2-イル、3-フルオロチオフェン-2-イル、チアゾール-4-イル、チアゾール-5-イル、チアゾール-2-イル、2,4-ジメチルチアゾール-5-イル、2-プロモ-4-メチルチアゾール-5-イル、2-クロロ-4-メチルチアゾール-5-イル、2-クロロ-4-エチルチアゾール-5-イル、2-クロロ-4-トリフルオロメチルチアゾール-5-イル、2-メチル-4-トリフルオロメチルチアゾール-5-イル、2-エチル-4-メチルチアゾール-5-イル、2-プロモ-4-エチルチアゾール-5-イル、2-エチル-4-メチルチアゾール-5-イル、2-メトキシ-4-メチルチアゾール-5-イル、2-クロロ-4-フルオロチアゾール-5-イル、2-フェニル-4-エトキシカルボニルチアゾール-5-イル、2-クロロチアゾール-4-イル、2-メチルチアゾール-4-イル、1-フェニル-5-メチルオキサゾール-4-イル、1,3-ジメチルオキサゾール-5-イル、3-メチルイソチアゾール-5-イル、3-ペンジルオキシ-5-メチルイソチアゾール-4-イル、4-クロロ-5-エトキシカルボニルイソチアゾール-3-イル、イソオキサゾール-5-イル、3,5-ジメチルイソオキサゾール-4-イル、5-メチルイソオキサゾール-3-イル、3-フェニル-5-メチルイソオキサゾール-4-イル、4-シアノイソオキサゾール-3-イル、1-メチルイミダゾール-5-イル、1-メチル-4,5-ジクロロイミダゾール-2-イル、1,5-ジメチル-2-クロロイミダゾール-4-イル、1-フェニル-5-メチル-1,2,3-トリアゾール-4-イル、1-フェニル-5-エチル-1,2,3-トリアゾール-4-イル、1-フェニル-5-ジプロモメチル-1,2,3-トリアゾール-4-イル、4-メチル-1,2,3-チアジアゾール-5-イル、4-エチル-1,2,3-チアジアゾール-5-イル、1,2,3-チアジアゾール-5-イル、1,2,3-チアジアゾール-4-イル、ピリジン-2-イル、ピリジン-3-イル、ピリジン-4-イル、6-メチルピリジン-3-イル、6-クロロピリジン-2-イル、6-フェノキスピリジン-2-イル、2-クロロピリジン-4-イル、2-フルオロピリジン-4-イル、2,6-ジクロロピリジン-4-イル、2-メトキスピリジン-4-イル、3,6-ジクロロピリジン-2-イル、2-クロロ-6-メチルピリジン-4-イル、3-フルオロピリジン-2-イル、3-フルオロピリジン-4-イル、キノキザリン-2-イル、6-クロロキノキザリン-2-イル、6-フルオロキノキザリン-2-イル、6-メトキシキノキザリン-2-イル、5-クロロキノキザリン-2-イル、5-フルオロキノキザリン-2-イル、5-メトキシ

キノキザリン-2-イル、1-メチルインドール-3-イル、1-メチル-2-クロロインドール-3-イル、1-メチル-2-フルオロインドール-3-イル、ベンゾチアゾール-2-イル、5-フルオロベンゾチアゾール-2-イル、6-フルオロベンゾチアゾール-2-イル、キノリン-4-イル、ピラジン-2-イル、3-クロロピラジン-2-イル、3-メチルピラジン-2-イル、3-エチルピラジン-2-イル、2-フェニル-4-メチルピリミジン-5-イル、2,4-ジメチルピリミジン-5-イル、4-トリフルオロメチルピリミジン-5-イル、4-ジフルオロクロロメチルピリミジン-5-イル、4-ペンタフルオロエチルピリミジン-5-イル、4-メチルチオピリミジン-5-イル、4-プロモジフルオロメチルピリミジン-5-イルおよび2-メチル-4-クロロジフルオロメチルピリミジン-5-イル等が挙げられる。

Y' の定義における R° で置換されていてもよいヘテロアリール C₁ ~ C₆ アルコキシとしては、直鎖または分岐状のヘテロアリールアルコキシとしてピリジン-2-イルメチルオキシ、5-クロロチオフェン-2-イルメチルオキシ、1-メチル-3-クロロピラゾール-5-イルメチルオキシ、2- (3-メチルフラン-2-イル) エチルオキシ、3- (6-トリフルオロメチルピリジン-2-イル) プロピルオキシ、4- (ピリミジン-2-イル) ブチルオキシ、5- (トリアゾール-1-イル) ペンチルオキシおよび6- (ピロール-1-イル) ヘキシリオキシ等が挙げられる。

Y' における、R° で置換されていてもよいヘテロアリール C₁ ~ C₆ アルキル、R° で置換されていてもよいヘテロアリール C₁ ~ C₆ アルキルスルフェニル、R° で置換されていてもよいヘテロアリール C₁ ~ C₆ アルキルスルフィニル、R° で置換されていてもよいヘテロアリール C₁ ~ C₆ アルキルスルホニル、R° で置換されていてもよいヘテロアリール C₁ ~ C₆ アルキルカルボニルおよびR° で置換されていてもよいヘテロアリール C₁ ~ C₆ アルキルカルボニルオキシで定義される、R° で置換されていてもよいヘテロアリール C₁ ~ C₆ アルキルとしては、直鎖または分岐状のヘテロアリールアルキルとしてピリジン-2-イルメチル、5-クロロチオフェン-2-イルメチル、1-メチル-3-クロロピラゾール-5-イルメチル、2- (3-メチルフラン-2-イル) エチル、3- (6-トリフルオロメチルピリジン-2-イル) プロピル、4- (ピリミジン-2-イル) ブチル、5- (トリアゾール-1-イル) ペンチルおよび6- (ピロール-1-イル) ヘキシリ等が挙げられる。

Y' における、R°で置換されていてもよいヘテロアリールオキシおよびR°で置換されていてもよいヘテロアリールオキシカルボニルで定義される、R°で置換されていてもよいヘテロアリールオキシとしては、5-クロロチオフェン-2-イルオキシ、3,5-ジメチルフラン-2-イルオキシ、3-シアノ-1-メチルピロール-1-イルオキシ、オキサゾール-2-イルオキシ、2-メチルスルフェニルオキサゾール-4-イルオキシ、4-メチルチアゾール-2-イルオキシ、2-トリフルオロメチルイミダゾール-4-イルオキシ、イソキサゾール-3-イルオキシ、3-クロロイソキサゾール-4-イルオキシ、3-メチルイソチアゾール-5-イルオキシ、1-ベンジル-3-フェニルピラゾール-5-イルオキシ、1-メチルピラゾール-5-イルオキシ、2-メチルスルホニル-1,3,4-オキサジアゾール-5-イルオキシ、2-プロモ-1,3,4-チアジアゾール-5-イルオキシ、1,2,4-オキサジアゾール-3-イルオキシ、1,2,4-チアジアゾール-5-イルオキシ、1,2,4-トリアゾール-3-イルオキシ、1,2,3-チアジアゾール-5-イルオキシ、1,2,3-トリアゾール-5-イルオキシ、1,2,3,4-テトラゾール-5-イルオキシ、6-フェノキシピリジン-2-イルオキシ、6-メトキシピリミジン-2-イルオキシ、ピラジン-2-イルオキシ、ピリダジン-3-イルオキシ、1,3,5-トリアジン-2-イルオキシおよび1,2,4-トリアジン-6-イルオキシ等が挙げられる。

Y' の定義におけるナフチルとしては、1-ナフチルおよび2-ナフチルがあげられる。

R°およびY' におけるR°で置換されていてもよいC₁～C₆アルキルスルフェニル、R°で置換されていてもよいC₁～C₆アルキルスルフィニル、R°で置換されていてもよいC₁～C₆アルキルスルホニル、R°で置換されていてもよいC₁～C₆アルキルカルボニルおよびR°で置換されていてもよいC₁～C₆アルキルカカルボニルオキシで定義される、R°で置換されていてもよいC₁～C₆アルキルとしては、直鎖または分岐状のアルキルとしてメチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、t-ブチル、s-ブチル、n-ペンチル、n-ヘキシル、2-エチルプロピル、2,2-ジメチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、1,1,2-トリメチルプロピル、1,2,2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピル、1-エチル-2-メチルプロピル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、1,1-ジメチルブチル、1,2-ジメチルブチル、1,3-ジメチルブチル、2,2-ジメチル

ブチル、2,3-ジメチルブチル、3,3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、フルオロメチル、クロロメチル、プロモメチル、ヨードメチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、プロモジフルオロメチル、トリフルオロメチル、ジクロロメチル、トリクロロメチル、1-クロロエチル、1-ブロモエチル、1-ヨードエチル、1-フルオロエチル、2-クロロエチル、2-ブロモエチル、2-ヨードエチル、2-フルオロエチル、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、2,2,2-トリクロロエチル、ペンタフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロ-1-クロロエチル、3-フルオロプロピル、3-クロロプロピル、1-フルオロ-i-プロピル、1-クロロ-i-プロピル、ヘプタフルオロプロピル、1,1,2,2,3,3-ヘキサフルオロプロピル、4-クロロブチル、4-フルオロブチル、5-クロロベンチル、5-フルオロベンチル、6-クロロヘキシル、6-フルオロヘキシル、メトキシメチル、エトキシメチル、n-プロポキシメチル、i-プロポキシメチル、n-ブトキシメチル、i-ブトキシメチル、s-ブトキシメチル、t-ブトキシメチル、n-ペンチルオキシメチル、2-メトキシエチル、3-エトキシプロピル、3-メトキシプロピル、メチルチオメチル、エチルチオメチル、n-プロピルチオメチル、i-プロピルチオメチル、n-ブチルチオメチル、i-ブチルチオメチル、s-ブチルチオメチル、t-ブチルチオメチル、n-ペンチルチオメチル、2-メチルチオエチル、3-エチルチオプロピル、3-メチルチオプロピル、ベンジル、2-クロロベンジル、3-ブロモベンジル、4-クロロベンジル、4-メチルベンジル、4-t-ブチルベンジル、2-メチルベンジル、2-メトキシベンジル、1-フェニルエチル、1-(3-クロロフェニル)エチル、2-フェニルエチル、1-メチル-1-フェニルエチル、1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-フェニルプロピル、2-フェニルプロピル、3-フェニルプロピル、1-フェニルブチル、2-フェニルブチル、3-フェニルブチル、4-フェニルブチル、1-メチル-1-フェニルプロピル、1-メチル-2-フェニルプロピル、1-メチル-3-フェニルプロピル、2-メチル-2-フェニルプロピル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルプロピル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)プロピル、1-フェニルベンチル、2-フェニルベンチル、3-フェニルベンチル、4-フェニルベンチル、5-フェニルベンチル、1-メチル-1-フェニルブチル、1-

メチル-2-フェニルブチル、1-メチル-3-フェニルブチル、1-メチル-4-フェニルブチル、2-メチル-2-フェニルブチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルブチル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ブチル、1-フェニルヘキシル、2-フェニルヘキシル、3-フェニルヘキシル、4-フェニルヘキシル、5-フェニルヘキシル、6-フェニルヘキシル、1-メチル-1-フェニルペンチル、1-メチル-2-フェニルペンチル、1-メチル-3-フェニルペンチル、1-メチル-4-フェニルペンチル、2-メチル-2-フェニルペンチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルペンチル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ペンチル、ピリジン-2-イルメチル、5-クロロチオフェン-2-イルメチル、1-メチル-3-クロロピラゾール-5-イルメチル、2-(3-メチルフラン-2-イル)エチル、3-(6-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)プロピル、4-(ピリミジン-2-イル)ブチル、5-(トリアゾール-1-イル)ペンチルおよび6-(ピロール-1-イル)ヘキシル等が挙げられる。

R^aおよびY'におけるR^bで置換されていてもよいC₂～C₆アルケニルオキシ、R^bで置換されていてもよいC₂～C₆アルケニルスルフェニル、R^bで置換されていてもよいC₂～C₆アルケニルスルフィニルおよびR^bで置換されていてもよいC₂～C₆アルケニルスルホニルで定義される、R^bで置換されていてもよいC₂～C₆アルケニルとしては、直鎖または分岐状のアルケニルとしてエテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1,1-ジメチル-2-プロペニル、1,2-ジメチル-2-プロペニル、1-エチル-2-プロペニル、1-メチル-2-ブテニル、2-メチル-2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル、2-メチル-3-ブテニル、3-メチル-3-ブテニル、1,1-ジメチル-2-ブテニル、1,1-ジメチル-3-ブテニル、1,2-ジメチル-2-ブテニル、1,2-ジメチル-3-ブテニル、1,3-ジメチル-2-ブテニル、1,3-ジメチル-3-ブテニル、2,3-ジメチル-2-ブテニル、2,3-ジメチル-3-ブテニル、3,3-ジメチル-2-ブテニル、1-エチル-2-ブテニル、1-エチル-3-ブテニル、2-エチル-2-ブテニル、2-エチル-3-ブテニル、1-メチル-2-ペンテニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-2-ペンテニル、4-メチル-2-ペンテニル、1-メチル-3-ペンテニ

ル、2-メチル-3-ペンテニル、3-メチル-3-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル、1-メチル-4-ペンテニル、2-メチル-4-ペンテニル、3-メチル-4-ペンテニル、4-メチル-4-ペンテニル、1,1,2-トリメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-メチル-2-プロペニル、2-クロロエテニル、2-プロモエテニル、2,2-ジクロロエテニル、3-クロロ-2-プロペニル、3-フルオロ-2-プロペニル、3-プロモ-2-プロペニル、3-ヨード-2-プロペニル、3,3-ジクロロ-2-プロペニル、3,3-ジフルオロ-2-プロペニル、4-クロロ-2-ブテニル、4,4-ジクロロ-3-ブテニルおよび4,4-ジフルオロ-3-ブテニル等が挙げられる。

R^aおよびY'におけるR^bで置換されていてもよいC₂～C₆アルキニルオキシ、R^bで置換されていてもよいC₂～C₆アルキニルスルフェニル、R^bで置換されていてもよいC₂～C₆アルキニルスルフィニル、およびR^bで置換されていてもよいC₂～C₆アルキニルとしては、直鎖または分岐状のアルキニルとしてエチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-メチル-2-プロピニル、1,1-ジメチル-2-プロピニル、1-メチル-1-エチル-2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-ブチニル、1-メチル-3-ブチニル、2-メチル-3-ブチニル、1,1-ジメチル-2-ブチニル、1,1-ジメチル-3-ブチニル、1,2-ジメチル-3-ブチニル、2,2-ジメチル-3-ブチニル、1-エチル-2-ブチニル、1-エチル-3-ブチニル、2-エチル-3-ブチニル、1-ペンチニル、2-ペンチニル、3-ペンチニル、4-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、1-メチル-4-ペンチニル、2-メチル-3-ペンチニル、2-メチル-4-ペンチニル、3-メチル-4-ペンチニル、4-メチル-2-ペンチニル、ヘキシニル、クロロエチニル、プロモエチニル、ヨードエチニル、3-クロロ-2-プロピニル、3-プロモ-2-プロピニル、3-ヨード-2-プロピニル、4-ブロモ-3-ブチニル、4-ヨード-3-ブチニルおよび6-ヨード-5-ヘキシニル等が挙げられる。

R^aおよびY'におけるR^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルコキシカルボニルで定義される、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルコキシとしては、直鎖または分岐状のアルコキシとしてメトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、i-ブロポキシ、n-ブトキシ、i-ブトキシ、s-ブトキシ、t-ブトキシ、n-ペンチルオキシ、n-ヘキシルオキシ、1,1-ジメチルプロポキシ、1,2-ジメチルプロポキシ、2,

2-ジメチルプロポキシ、1-エチルプロポキシ、1,1,2-トリメチルプロポキシ、1,2,2-トリメチルプロポキシ、1-エチル-1-メチルプロポキシ、1-エチル-2-メチルプロポキシ、1-メチルブトキシ、2-メチルブトキシ、3-メチルブトキシ、1-エチルブトキシ、2-エチルブトキシ、1,1-ジメチルブトキシ、1,2-ジメチルブトキシ、1,3-ジメチルブトキシ、2,2-ジメチルブトキシ、2,3-ジメチルブトキシ、3,3-ジメチルブトキシ、1-メチルペンチルオキシ、2-メチルペンチルオキシ、3-メチルペンチルオキシ、4-メチルペンチルオキシ、フルオロメトキシ、クロロメトキシ、プロモメトキシ、ヨードメトキシ、ジクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、プロモジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、1-クロロエトキシ、1-ブロモエトキシ、1-ヨードエトキシ、1-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2-ブロモエトキシ、2-ヨードエトキシ、2-フルオロエトキシ、2,2-ジフルオロエトキシ、2,2,2-トリフルオロエトキシ、2,2,2-トリクロロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、2,2,2-トリフルオロ-1-クロロエトキシ、1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ、3-ブロモプロポキシ、1-フルオロ-i-プロポキシ、1-クロロ-i-プロポキシ、3-フルオロプロポキシ、3-クロロプロポキシ、ヘプタフルオロプロポキシ、1,1,2,2,3,3-ヘキサフルオロプロポキシ、4-クロロブトキシ、4-フルオロブトキシ、5-クロロベンチルオキシ、5-フルオロベンチルオキシ、6-クロロヘキシルオキシ、6-フルオロヘキシルオキシ、ベンジルオキシ、2-クロロベンジルオキシ、3-ブロモベンジルオキシ、4-クロロベンジルオキシ、4-メチルベンジルオキシ、4-t-ブチルベンジルオキシ、2-メチルベンジルオキシ、2-メトキシベンジルオキシ、1-フェニルエチルオキシ、1-(3-クロロフェニル)エチルオキシ、2-フェニルエチルオキシ、1-メチル-1-フェニルエチルオキシ、1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチルオキシ、1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチルオキシ、1-フェニルプロピルオキシ、2-フェニルプロピルオキシ、3-フェニルプロピルオキシ、1-フェニルブチルオキシ、2-フェニルブチルオキシ、3-フェニルブチルオキシ、4-フェニルブチルオキシ、1-メチル-1-フェニルプロピルオキシ、1-メチル-2-フェニルプロピルオキシ、1-メチル-3-フェニルプロピルオキシ、2-メチル-2-フェニルプロピルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルプロピルオキシ

、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)プロピルオキシ、1-フェニルペンチルオキシ、2-フェニルペンチルオキシ、3-フェニルペンチルオキシ、4-フェニルペンチルオキシ、5-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-1-フェニルブチルオキシ、1-メチル-2-フェニルブチルオキシ、1-メチル-3-フェニルブチルオキシ、1-メチル-4-フェニルブチルオキシ、2-メチル-2-フェニルブチルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルブチルオキシ、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ブチルオキシ、1-フェニルヘキシルオキシ、2-フェニルヘキシルオキシ、3-フェニルヘキシルオキシ、4-フェニルヘキシルオキシ、5-フェニルヘキシルオキシ、6-フェニルヘキシルオキシ、1-メチル-1-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-2-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-3-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-4-フェニルペンチルオキシ、2-メチル-2-フェニルペンチルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルペンチルオキシ、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ペンチルオキシ、ピリジン-2-イルメチルオキシ、5-クロロチオフェン-2-イルメチルオキシ、1-メチル-3-クロロピラゾール-5-イルメチルオキシ、2-(3-メチルフラン-2-イル)エチルオキシ、3-(6-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)プロピルオキシ、4-(ピリミジン-2-イル)ブチルオキシ、5-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)ペンチルオキシおよび6-(ピロール-1-イル)ヘキシルオキシ等が挙げられる。

R^aおよびY'の定義におけるR^bで置換されていてよいC₁～C₁₂アルキルとしては、直鎖または分岐状のアルキルとしてメチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、t-ブチル、s-ブチル、n-ペンチル、n-ヘキシル、n-ヘプチル、n-オクチル、n-ノニル、n-デカニル、2-エチルプロピル、2,2-ジメチルプロピル、1,2-ジメチルプロピル、1,1,2-トリメチルプロピル、1,2,2-トリメチルプロピル、1-エチル-1-メチルプロピル、1-エチル-2-メチルプロピル、1-メチルブチル、2-メチルブチル、3-メチルブチル、1,1-ジメチルブチル、1,2-ジメチルブチル、1,3-ジメチルブチル、2,2-ジメチルブチル、2,3-ジメチルブチル、3,3-ジメチルブチル、1-エチルブチル、2-エチルブチル、1-メチルペンチル、2-メチルペンチル、3-メチルペンチル、4-メチルペンチル、2-エチルヘキシル、フルオロメチル、クロロメチル、プロモメチル、ヨードメチル、ジフルオロメチル、クロロジフルオロメチル、プロモジフルオロメチル、トリフルオロメチル

、ジクロロメチル、トリクロロメチル、1-クロロエチル、1-プロモエチル、1-ヨードエチル、1-フルオロエチル、2-クロロエチル、2-プロモエチル、2-ヨードエチル、2-フルオロエチル、2,2-ジフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロエチル、2,2,2-トリクロロエチル、ペンタフルオロエチル、2,2,2-トリフルオロ-1-クロロエチル、3-フルオロプロピル、3-クロロプロピル、1-フルオロ-i-プロピル、1-クロロ-i-プロピル、ヘptaフルオロプロピル、1,1,2,2,3,3-ヘキサフルオロプロピル、4-クロロブチル、4-フルオロブチル、5-クロロペンチル、5-フルオロペンチル、6-クロロヘキシル、6-フルオロヘキシル、7-フルオロヘプチル、8-クロロオクチル、メトキシメチル、エトキシメチル、n-プロポキシメチル、i-プロポキシメチル、n-ブトキシメチル、i-ブトキシメチル、s-ブトキシメチル、t-ブトキシメチル、n-ペンチルオキシメチル、2-メトキシエチル、3-エトキシプロピル、3-メトキシプロピル、メチルチオメチル、エチルチオメチル、n-プロピルチオメチル、i-プロピルチオメチル、n-ブチルチオメチル、i-ブチルチオメチル、s-ブチルチオメチル、t-ブチルチオメチル、n-ペンチルチオメチル、2-メチルチオエチル、3-エチルチオプロピル、3-メチルチオプロピル、ベンジル、2-クロロベンジル、3-プロモベンジル、4-クロロベンジル、4-メチルベンジル、4-t-ブチルベンジル、2-メチルベンジル、2-メトキシベンジル、1-フェニルエチル、1-(3-クロロフェニル)エチル、2-フェニルエチル、1-メチル-1-フェニルエチル、1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチル、1-フェニルプロピル、2-フェニルプロピル、3-フェニルプロピル、1-フェニルブチル、2-フェニルブチル、3-フェニルブチル、4-フェニルブチル、1-メチル-1-フェニルプロピル、1-メチル-2-フェニルプロピル、1-メチル-3-フェニルプロピル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)プロピル、1-フェニルペンチル、2-フェニルペンチル、3-フェニルペンチル、4-フェニルペンチル、5-フェニルペンチル、1-メチル-1-フェニルブチル、1-メチル-2-フェニルブチル、1-メチル-3-フェニルブチル、1-メチル-4-フェニルブチル、2-メチル-2-フェニルブチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルブチル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ブチル、1-フェニルヘキシル、2-フェニルヘキシル、3-フェニルヘキシル、4-フェニル

ヘキシル、5-フェニルヘキシル、6-フェニルヘキシル、1-メチル-1-フェニルベンチル、1-メチル-2-フェニルベンチル、1-メチル-3-フェニルベンチル、1-メチル-4-フェニルベンチル、2-メチル-2-フェニルベンチル、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルベンチル、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ベンチル、ビリジン-2-イルメチル、5-クロロチオフェン-2-イルメチル、1-メチル-3-クロロピラゾール-5-イルメチル、2-(3-メチルフラン-2-イル)エチル、3-(6-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)プロピル、4-(ビリミジン-2-イル)ブチル、5-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)ベンチル、6-(ピロール-1-イル)ヘキシル、シクロプロピルメチル、シクロブチルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチル、2,2-ジクロロシクロプロピルメチル、1-フェニルピラゾール-5-カルボキシメチル、テトラヒドロピラン-2-イルメチル、イミダゾール-1-イルメチル、2-ジフルオロメトキシエチル、2-メチルスルフェニルエチル、3-シアノプロピル、2-ホルミル-2-メチルプロピル、4-メトキシカルボニル-4-シアノブチル、5-(2-クロロフェニル)ベンチル、1-フェニル-1-メトキシメチル、1-フェニル-1-エトキシメチル、1-(2-クロロフェニル)-1-メトキシメチル、1-(3-クロロフェニル)-1-メトキシメチル、1-(4-クロロフェニル)-1-メトキシメチル、1-(2-フルオロフェニル)-1-メトキシメチル、1-(3-フルオロフェニル)-1-メトキシメチル、1-(4-フルオロフェニル)-1-メトキシメチル、1-(2-メチルフェニル)-1-メトキシメチル、1-(3-メチルフェニル)-1-メトキシメチル、1-(4-メチルフェニル)-1-メトキシメチル、1-フェニル-1-クロロメチル、1-フェニル-1,1-ジメトキシメチルおよび6-モルホリノヘキシル等が挙げられる。

R°およびY°の定義におけるR°で置換されていてもよいC₁～C₁₂アルケニルとしては、直鎖または分岐状のアルケニルとしてエテニル、1-プロペニル、2-プロペニル、1-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-ペンテニル、2-ペンテニル、3-ペンテニル、4-ペンテニル、1-ヘキセニル、2-ヘキセニル、3-ヘキセニル、4-ヘキセニル、5-ヘキセニル、6-ヘプテニル、7-オクテニル、8-ノネニル、9-デセニル、1-メチル-2-プロペニル、2-メチル-2-プロペニル、1,1-ジメチル-2-プロペニル、1,2-ジメチル-2-プロペニル、1-エチル-2-プロペニル、1-メチル-2-ブテニル、2-メチル-2-ブテニル、3-メチル-2-ブテニル、1-メチル-3-ブテニル

、2-メチル-3-ブテニル、3-メチル-3-ブテニル、1,1-ジメチル-2-ブテニル、1,1-ジメチル-3-ブテニル、1,2-ジメチル-2-ブテニル、1,2-ジメチル-3-ブテニル、1,3-ジメチル-2-ブテニル、1,3-ジメチル-3-ブテニル、2,3-ジメチル-2-ブテニル、2,3-ジメチル-3-ブテニル、3,3-ジメチル-2-ブテニル、1-エチル-2-ブテニル、1-エチル-3-ブテニル、2-エチル-2-ブテニル、2-エチル-3-ブテニル、1-メチル-2-ペンテニル、2-メチル-2-ペンテニル、3-メチル-2-ペンテニル、4-メチル-2-ペンテニル、1-メチル-3-ペンテニル、2-メチル-3-ペンテニル、3-メチル-3-ペンテニル、4-メチル-3-ペンテニル、1-メチル-4-ペンテニル、2-メチル-4-ペンテニル、3-メチル-4-ペンテニル、4-メチル-4-ペンテニル、1,1,2-トリメチル-2-プロペニル、1-エチル-1-メチル-2-プロペニル、2-クロロエテニル、2-ブロモエテニル、2,2-ジクロロエテニル、3-クロロ-2-プロペニル、3-フルオロ-2-プロペニル、3-ブロモ-2-プロペニル、3-ヨード-2-プロペニル、3,3-ジクロロ-2-プロペニル、3,3-ジフルオロ-2-プロペニル、4-クロロ-2-ブテニル、4,4-ジクロロ-3-ブテニル、4,4-ジフルオロ-3-ブテニル、2-フェニルエテニル、3-シアノ-2-プロペニル、4- (4-クロロフェニル) -4-エトキシカルボニル-3-ブテニル、3- (チアゾール-2-カルボニルオキシ) -4-メトキシ-3-ブテニル、2-フェニルエテニル、2- (4-クロロフェニル) エテニル、2- (3-クロロフェニル) エテニル、2- (2-クロロフェニル) エテニル、2- (4-フルオロフェニル) エテニル、2- (3-フルオロフェニル) エテニル、2- (2-フルオロフェニル) エテニル、2- (4-メチルフェニル) エテニル、2- (3-メチルフェニル) エテニル、2- (2-メチルフェニル) エテニル、2-フェニル-1,2-ジプロモエテニルおよび6- (ピラゾール-1-イル) -3-ヘキセニル等が挙げられる。

R°およびY°の定義におけるR°で置換されていてもよいC₂～C₁₂アルキニルとしては、直鎖または分岐状のアルキニルとしてエチニル、1-プロピニル、2-プロピニル、1-メチル-2-プロピニル、1,1-ジメチル-2-プロピニル、1-メチル-1-エチル-2-プロピニル、1-ブチニル、2-ブチニル、3-ブチニル、1-メチル-2-ブチニル、1-メチル-3-ブチニル、2-メチル-3-ブチニル、1,1-ジメチル-2-ブチニル、1,1-ジメチル-3-ブチニル、1,2-ジメチル-3-ブチニル、2,2-ジメチル-3-ブチニル、1-エチル-2-ブチニル、1-エチル-3-ブチニル、2-エチル-3-ブチニル、1

-ペンチニル、2-ペンチニル、3-ペンチニル、4-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、1-メチル-4-ペンチニル、2-メチル-3-ペンチニル、2-メチル-4-ペンチニル、3-メチル-4-ペンチニル、4-メチル-2-ペンチニル、ヘキシニル、クロロエチニル、プロモエチニル、ヨードエチニル、3-クロロ-2-プロピニル、3-プロモ-2-プロピニル、3-ヨード-2-プロピニル、4-プロモ-3-ブチニル、4-ヨード-3-ブチニル、6-ヨード-5-ヘキシニル、4-(2-クロロチアゾール-5-イル)-3-ブチニル、5-ホルミル-3-ペンチニル、6-メチルスルフェニル-5-ヘキシニル、2-フェニルエチニルおよび3-シアノ-5-ヘキシニル等が挙げられる。

R^aおよびY'の定義におけるR^bで置換されていてもよいC₁～C₁₂アルコキシとしては、直鎖または分岐状のアルコキシとしてメトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、i-プロポキシ、n-ブトキシ、i-ブトキシ、s-ブトキシ、t-ブトキシ、n-ペンチルオキシ、n-ヘキシルオキシ、1,1-ジメチルプロポキシ、1,2-ジメチルプロポキシ、2,2-ジメチルプロポキシ、1-エチルプロポキシ、1,1,2-トリメチルプロポキシ、1,2,2-トリメチルプロポキシ、1-エチル-1-メチルプロポキシ、1-エチル-2-メチルプロポキシ、1-メチルブトキシ、2-メチルブトキシ、3-メチルブトキシ、1-エチルブトキシ、2-エチルブトキシ、1,1-ジメチルブトキシ、1,2-ジメチルブトキシ、1,3-ジメチルブトキシ、2,2-ジメチルブトキシ、2,3-ジメチルブトキシ、3,3-ジメチルブトキシ、1-メチルペンチルオキシ、2-メチルペンチルオキシ、3-メチルペンチルオキシ、4-メチルペンチルオキシ、n-ヘプチルオキシ、n-オクチルオキシ、n-ノニルオキシ、n-デカニルオキシ、フルオロメトキシ、クロロメトキシ、プロモメトキシ、ヨードメトキシ、ジクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、クロロジフルオロメトキシ、プロモジフルオロメトキシ、ジクロロフルオロメトキシ、1-クロロエトキシ、1-プロモエトキシ、1-ヨードエトキシ、1-フルオロエトキシ、2-クロロエトキシ、2-プロモエトキシ、2-ヨードエトキシ、2-フルオロエトキシ、2,2-ジフルオロエトキシ、2,2,2-トリフルオロエトキシ、2,2,2-トリクロロエトキシ、ペンタフルオロエトキシ、2,2,2-トリフルオロ-1-クロロエトキシ、1,1,2,2-テトラフルオロエトキシ、3-プロモプロポキシ、1-フルオロ-i-プロポキシ、1-クロロ-i-プロポキシ、3-フルオロプロポキシ、3-クロロプロポキシ、ヘプタフル

オロプロボキシ、1,1,2,2,3,3-ヘキサフルオロプロボキシ、4-クロロブロトキシ、4-フルオロブロトキシ、5-クロロベンチルオキシ、5-フルオロベンチルオキシ、6-クロロヘキシルオキシ、6-フルオロヘキシルオキシ、ベンジルオキシ、2-クロロベンジルオキシ、3-プロモベンジルオキシ、4-クロロベンジルオキシ、4-メチルベンジルオキシ、4-t-ブチルベンジルオキシ、2-メチルベンジルオキシ、2-メトキシベンジルオキシ、1-フェニルエチルオキシ、1-(3-クロロフェニル)エチルオキシ、2-フェニルエチルオキシ、1-メチル-1-フェニルエチルオキシ、1-(4-クロロフェニル)-1-メチルエチルオキシ、1-(3-クロロフェニル)-1-メチルエチルオキシ、1-フェニルプロピルオキシ、2-フェニルプロピルオキシ、3-フェニルプロピルオキシ、1-フェニルブチルオキシ、2-フェニルブチルオキシ、3-フェニルブチルオキシ、4-フェニルブチルオキシ、1-メチル-1-フェニルプロピルオキシ、1-メチル-2-フェニルプロピルオキシ、1-メチル-3-フェニルプロピルオキシ、2-メチル-2-フェニルプロピルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルプロピルオキシ、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)プロピルオキシ、1-フェニルペンチルオキシ、2-フェニルペンチルオキシ、3-フェニルペンチルオキシ、4-フェニルペンチルオキシ、5-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-1-フェニルブチルオキシ、1-メチル-2-フェニルブチルオキシ、1-メチル-3-フェニルブチルオキシ、1-メチル-4-フェニルブチルオキシ、2-メチル-2-フェニルブチルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルブチルオキシ、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ブチルオキシ、1-フェニルヘキシルオキシ、2-フェニルヘキシルオキシ、3-フェニルヘキシルオキシ、4-フェニルヘキシルオキシ、5-フェニルヘキシルオキシ、6-フェニルヘキシルオキシ、1-メチル-1-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-2-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-3-フェニルペンチルオキシ、1-メチル-4-フェニルペンチルオキシ、2-メチル-2-フェニルペンチルオキシ、2-(4-クロロフェニル)-2-メチルペンチルオキシ、2-メチル-2-(3-メチルフェニル)ペンチルオキシ、ピリジン-2-イルメチルオキシ、5-クロロチオフェン-2-イルメチルオキシ、1-メチル-3-クロロピラゾール-5-イルメチルオキシ、2-(3-メチルフラン-2-イル)エチルオキシ、3-(6-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)プロピルオキシ、4-(ピリミジン-2-イル)ブチルオキシ、5-(トリアゾール-1-イル)

ペンチルオキシ、

6-(ピロール-1-イル)ヘキシリオキシ、1-フェニルピラゾール-5-カルボキシメチルオキシ、テトラヒドロビラン-2-イルメチルオキシ、イミダゾール-1-イルメチルオキシ、2-ジフルオロメトキシエチルオキシ、2-メチルスルフェニルエチルオキシ、3-シアノプロピルオキシ、2-ホルミル-2-メチルプロピルオキシ、4-メトキシカルボニル-4-シアノブチルオキシ、5-(2-クロロフェニル)ペンチルオキシおよび6-モルホリノヘキシリオキシ等が挙げられる。

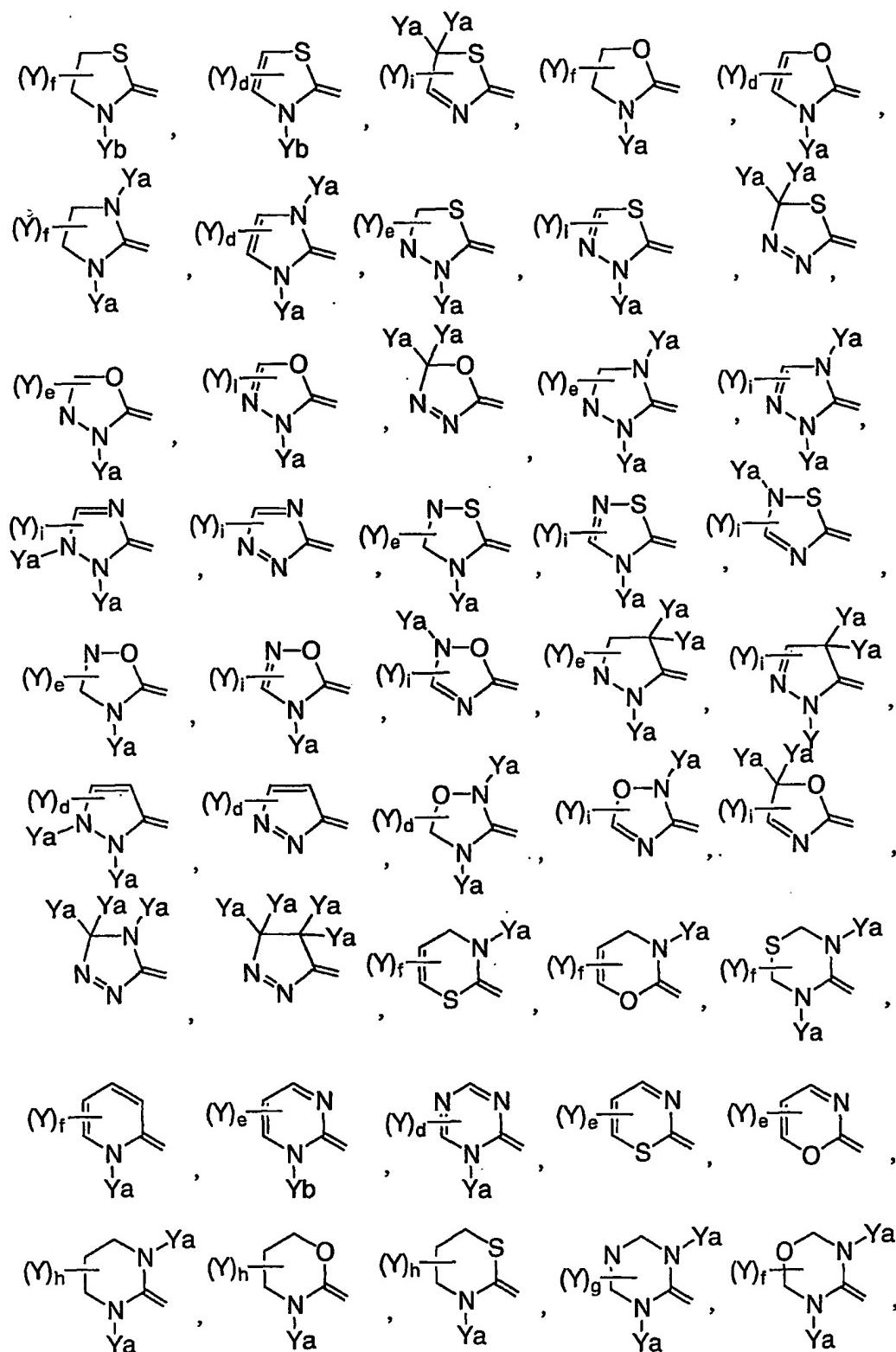
R¹およびY'の定義におけるR¹で置換されていてもよいC₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルコキシとしては、メトキシメトキシ、エトキシメトキシ、n-プロポキシメトキシ、i-プロポキシメトキシ、n-ブトキシメトキシ、i-ブトキシメトキシ、s-ブトキシメトキシ、t-ブトキシメトキシ、n-ペンチルオキシメトキシ、2-メトキシエトキシ、3-エトキシプロポキシ、3-メトキシプロポキシ、シアノメトキシメトキシ、2-(2-ニトロエトキシ)エトキシ、3-(1-メチルピラゾール-5-イルメトキシ)プロピルオキシ、4-(3-シアノ-2-メチルプロピルオキシ)ブトキシ、5-ベンジルオキシペンチルオキシおよび5-(2-トリフルオロメチルチアソール-5-イル)メトキシヘキシリオキシ等が挙げられる。

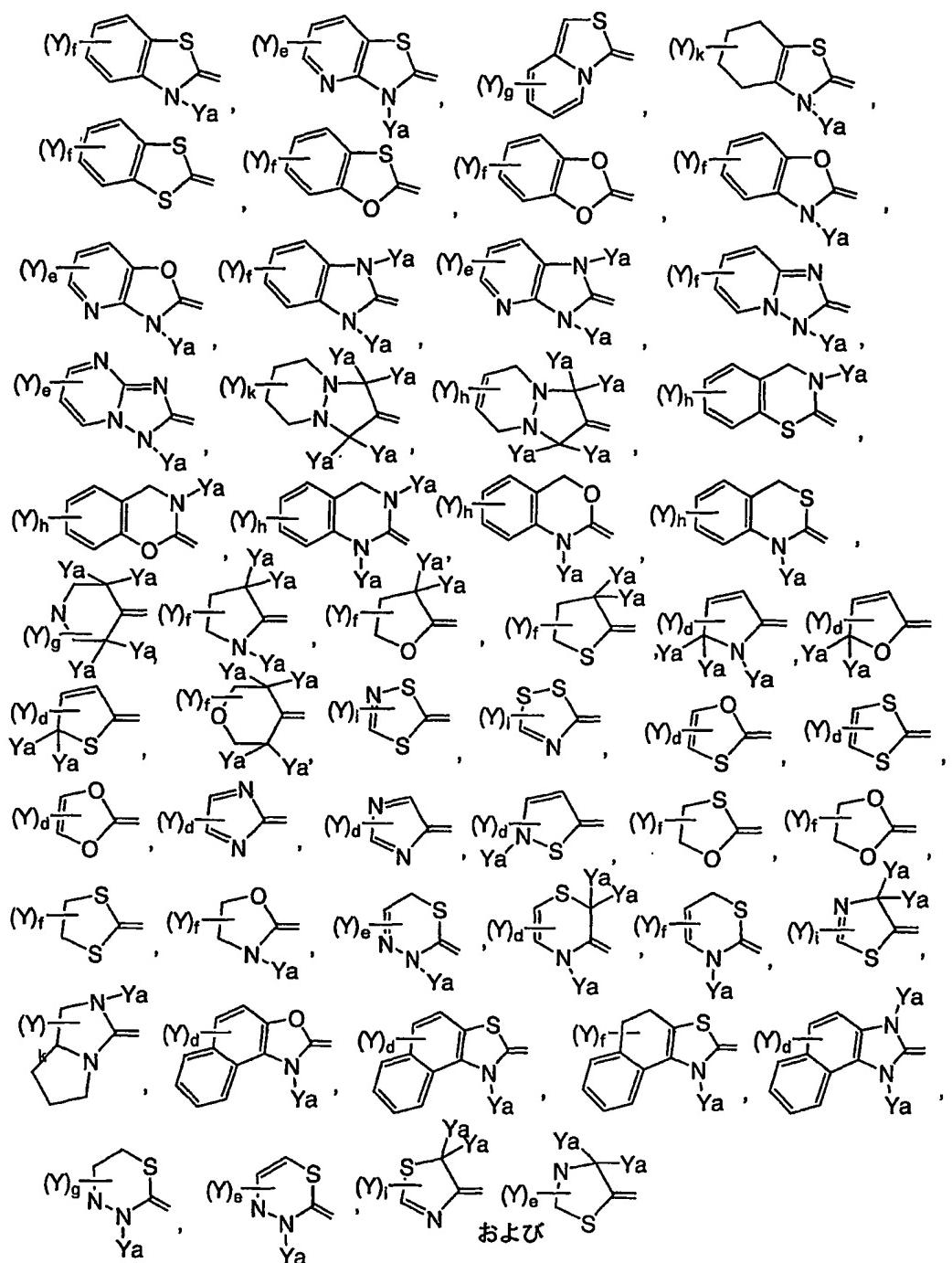
Yの定義における、Aの同一炭素上に置換した2個のYにより該炭素原子とともに酸素原子、窒素原子または硫黄原子を各々1から3個含んでいてもよい3から7員環としては、シクロプロピル、2,2-ジクロロシクロプロピル、シクロブチル、オキセタンおよびシクロペンチル等が挙げられる。

R²およびR³の定義における、R²およびR³とが一緒になって酸素原子、窒素原子または硫黄原子から選ばれた1から4個のヘテロ原子を含んでいてもよい3から7員環としては、アジリジン、モルホリン、ヘキサメチレンイミンおよび4-ベンジルピペラジン等が挙げられる。

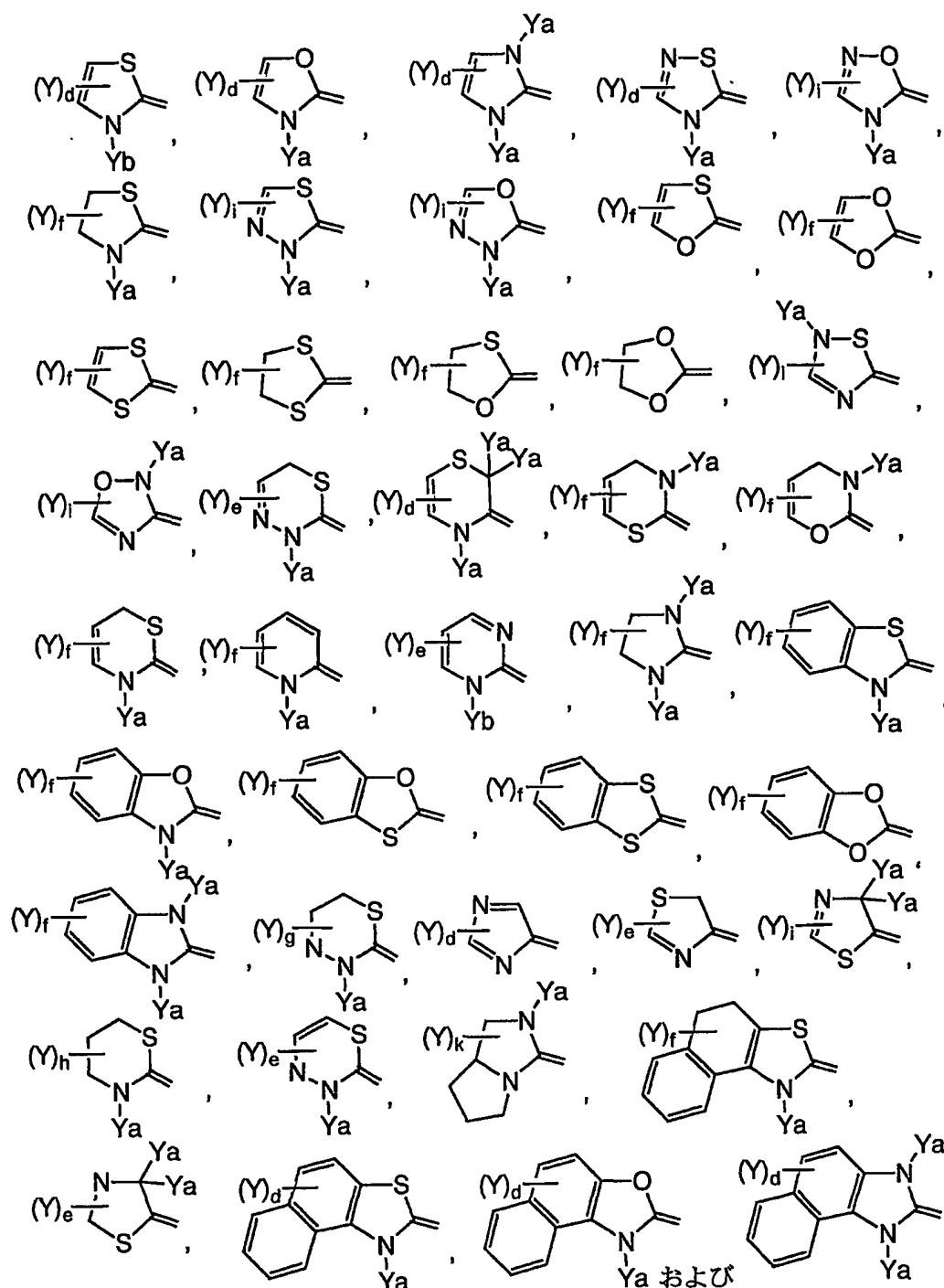
U¹およびU²の定義における、U¹およびU²とが一緒になって形成する、酸素原子、窒素原子または硫黄原子から選ばれた1から4個のヘテロ原子を含んでいてもよい3から7員環としては、アジリジン、モルホリン、ヘキサメチレンイミンおよび4-ベンジルピペラジン等が挙げられる。

Aとしては、好ましくは、

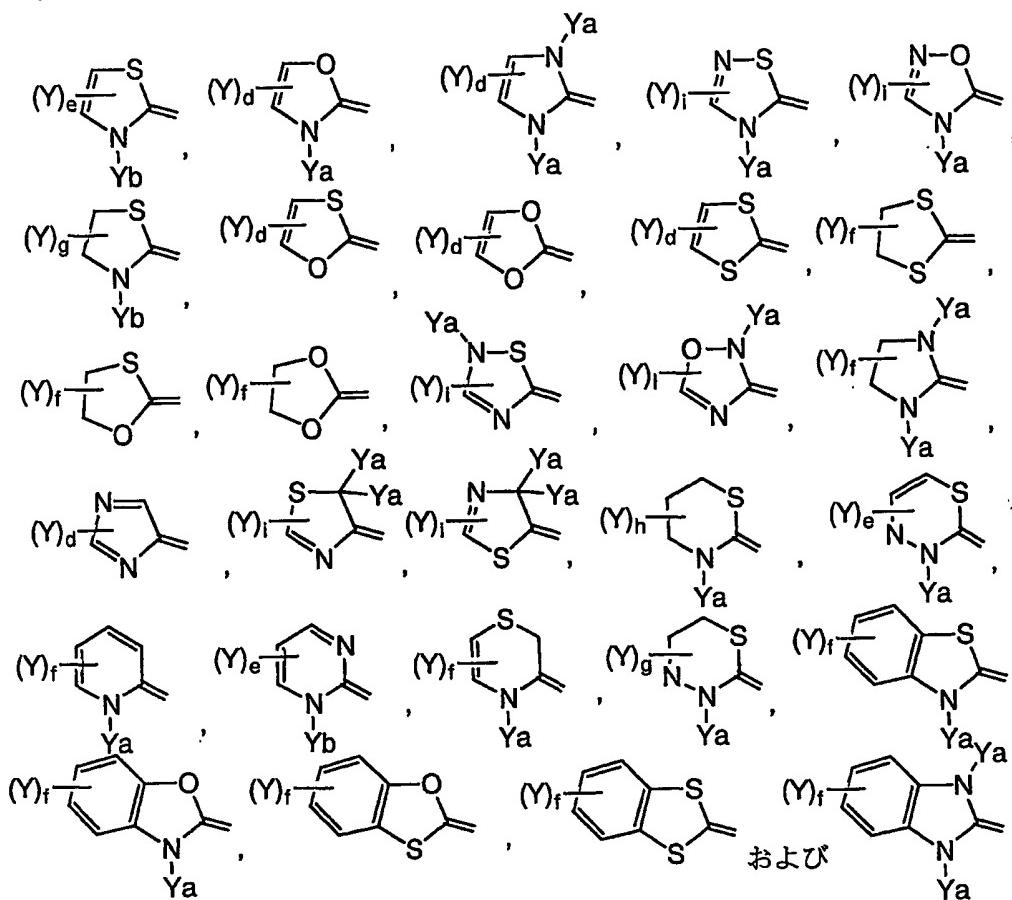




が挙げられ、更に好ましくは



が挙げられ、特に好ましくは



が挙げられる。なお、Y、Y_a、Y_b、d、e、f、g、h、i、jおよびkは前記と同様の意味を表す。

Bとしては $-CH_2-$ 、 $-C(=CH-OR^4)$ 、または $-C(=N-OR^4)$ が挙げられる。

R¹としては、好ましくは水素原子、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、n-ペンチル、3-メチルブチル、n-ヘキシルおよびベンジル等が挙げられ、より好ましくはメチルが挙げられる。

R²としては、好ましくは、水素原子、メチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、n-ペンチル、3-メチルブチル、n-ヘキシルおよびベンジル等が挙げられ、より好ましくはメチルが挙げられる。

R³としては、好ましくは、水素原子、メチル、エチル、R^aで置換されていてもよいフェニルおよびR^aで置換されていてもよいベンジル等が挙げられ、より

好ましくは水素原子、R^aで置換されていてもよいフェニルおよびメチルが挙げられる。

R⁴としては、水素原子、メチル、エチルおよびベンジル等が挙げられ、より好ましくはメチルが挙げられる。

R⁵としては、水素原子、メチル、アセチル、フェニルおよびベンジル等が挙げられ、より好ましくはメチルおよびアセチルが挙げられる。

R⁶としては、水素原子、塩素原子、メチル、エチル、メトキシカルボニル、メチルスルフェニル、R^aで置換されていてもよいフェニルおよびベンジル等が挙げられる。

R⁷としては、R^aで置換されていてもよいフェニル、R^aで置換されていてもよいヘテロアリール、水素原子、メチル、エチル、メトキシ、ベンジルオキシ、アセチルおよびR^aで置換されていてもよいベンジル等が挙げられる。

R⁸およびR⁹としては、水素原子、塩素原子、メチル、エチルおよびベンジル等が挙げられる。

R¹⁰としては、水素原子、塩素原子、メチルおよびメトキシ等が挙げられる。

R¹¹としては、水素原子、メチルおよびエチル等が挙げられる。

R¹²としては、水素原子およびメチル等が挙げられる。

R¹³としては、水素原子、塩素原子、臭素原子、メチルおよびメトキシ等が挙げられる。

R^aとしては、好ましくは、ハロゲン原子、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆ハロアルコキシ、CN、ニトロおよびC₁～C₆アルコキシカルボニル等が挙げられ、より好ましくは、Cl、F、Br、トリフルオロメチル、メトキシ、エトキシ、エチル、プロピルおよびメチルが挙げられる。

R^bとしては、好ましくは、ハロゲン原子、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆アルキルスルフェニル、R^aで置換されていてもよいフェニル、R^aで置換されていてもよいヘテロアリール、CN、ニトロおよびC₁～C₆アルコキシカルボニル等が挙げられる。

R^cとしては、好ましくは、ハロゲン原子、R^aで置換されていてもよいフェニル

ル、R^aで置換されていてもよいヘテロアリール、R^bで置換されていてもよいフェニルカルボニル、R^aで置換されていてもよいフェニルスルホニル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルキル、R^bで置換されていてもよいC₂～C₆アルケニル、R^bで置換されていてもよいC₂～C₆アルキニル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルコキシ、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルキルスルフェニル、CN、ニトロ、OH、SH、SCNおよびC₁～C₆アルコキシカルボニル等が挙げられる。

Xとしては、好ましくは、ハロゲン原子、C₁～C₄アルキル、C₁～C₄アルコキシ、C₁～C₂ハロアルキル、C₁～C₂ハロアルコキシ、CN、ニトロ、S-R、NU¹U²、R^aで置換されていてもよいフェニルカルボニルおよびC₁～C₄アルコキシカルボニル等が挙げられ、より好ましくは、Cl、F、I、Br、メトキシ、エチル、n-プロピル、エトキシ、n-プロポキシ、クロロジフルオロメチル、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、メトキシカルボニル、ペンタフルオロエチル、エトキシカルボニル、CN、アセチルおよびメチルが挙げられる。

Y'としては、好ましくは、水素原子、ハロゲン原子、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルキル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルコキシ、R^cで置換されていてもよいフェニル、R^cで置換されていてもよいフェノキシ、R^cで置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキル、R^cで置換されていてもよいヘテロアリール、CN、ニトロおよびC₁～C₆アルコキシカルボニル等が挙げられる。

U¹およびU²としては、好ましくは、水素原子、C₁～C₄アルキル、C₁～C₂ハロアルキル、フェニル、ヘテロアリール、C₁～C₄アルキルカルボニルおよびC₁～C₄アルコキシカルボニル等が挙げられ、より好ましくは、H、メチル、フェニル、ベンジル、アセチル、メトキシカルボニルが挙げられる。

Dとしては、好ましくは、単結合、-C(=Q²)-および-C(R^e)=N-O-が挙げられる。

Q¹、Q²、Q³としては、好ましくは、=O、=S、=N-R'および=CH₂である。

Q^4 および Q^5 としては、好ましくは、=O および=S である。

Q^6 としては、好ましくは、-O- および-S- である。

Q^7 としては、好ましくは、=N- および=CH- である。

G としては、 G^1 、 G^2 、 G^3 、 G^4 、 G^5 、 G^6 、 G^7 、 G^8 、 G^{15} および G^{16} が挙げられ、好ましくは、 G^1 、 G^2 、 G^3 、 G^4 、 G^{15} および G^{16} であり、さらに好ましくは、 G^1 および G^{15} である。

B としては、-CH₂-、-C (=CH-OR⁴) - および-C (=N-OR⁴) - が挙げられる。

B^1 としては、好ましくは、-N(OR⁴) -、-N(R⁵) -、-O- および-S- 等が挙げられ、さらに好ましくは、-N(OR⁴) - および-N(R⁵) - が挙げられる。

B^2 としては、好ましくは、-CH₂-、-C (=CH-OR⁴) -、-C (=N-OR⁴) - および-CH(OR⁴) - 等が挙げられる。

A^2 としては、好ましくは、 A^2a が挙げられる。

n は好ましくは 0、1 または 2 である。

p は好ましくは 0 または 1 である。

本願発明のヘテロ環イミノフェニル化合物の農薬として許容される塩としては、例えば塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩、ギ酸塩、酢酸塩、アンモニウム塩、イソプロピルアミン塩およびシウ酸塩等が挙げられる。

また、本発明化合物は、互変異性により式(1)のイミノ結合が変化しないものが好ましい。

次に、本発明化合物の防除対象となる植物病害としては、イネのいもち病 (*Pyricularia oryzae*)、ごま葉枯病 (*Cochliobolus miyabeanus*)、紋枯病 (*Rhizoctonia solani*)、ムギ類のうどんこ病 (*Erysiphe graminis*, f. sp. *hordei*, f. sp. *tritici*)、斑葉病 (*Pyrenophora graminea*)、網斑病 (*Pyrenophora teres*)、赤かび病 (*Gibberella zae*)、さび病 (*Puccinia striiformis*, *P. graminis*, *P. recondita*, *P. hordei*)、雪腐病 (*Typhula* sp., *Micronectriella nivais*)、裸黒穂病 (*Ustilago tritici*, *U. nuda*)、アイスポット (*Pseudocercospora herpotrichiae*)

ichoides)、雲形病 (Rhynchosporium secalis)、葉枯病 (Septoria tritici)、ふ枯病 (Leptosphaeria nodorum)、
カンキツの黒点病 (Diaporthe citri)、そうか病 (Elsinoe fawcetti)、果実
腐敗病 (Penicillium digitatum, P. italicum)、
リンゴのモニリア病 (Sclerotinia malii)、腐らん病 (Valsa mali)、うどんこ
病 (Podosphaera leucotricha)、斑点落葉病 (Alternaria mali)、黒星病 (Ve
nturia inaequalis)、
ナシの黒星病 (Venturia nashicola)、黒斑病 (Alternaria Kikuchiana)、赤
星病 (Gymnosporangium haraeanum)、
モモの灰星病 (Sclerotinia cinerea)、黒星病 (Cladosporium carpophilum)
、フォモプシス腐敗病 (Phomopsis sp.)、
ブドウのべと病 (Plasmopara viticola)、黒とう病 (Elsinoe ampelina)、晩
腐病 (Glomerella cingulata)、うどんこ病 (Uncinula necator)、さび病 (Ph
akopsora ampelopsis)、
カキの炭そ病 (Gloeosporium kaki)、落葉病 (Cercospora kaki, Mycosphaerel
la nawae)、
ウリ類のべと病 (Pseudoperenospora cubensis)、炭そ病 (Colletotrichum lag
enarium)、うどんこ病 (Sphaerotheca fuliginea)、つる枯病 (Mycosphaerell
a melonis)、
トマトの疫病 (Phytophthora infestans)、輪紋病 (Alternaria solani)、葉
かび病 (Cladosporium fulvum)、
ナスの褐紋病 (Phomopsis vexans)、うどんこ病 (Erysiphe cichoracearum)、
アブラナ科野菜の黒斑病 (Alternaria japonica)、白斑病 (Cerocosporella br
assicae)、
ネギのさび病 (Puccinia allii)、
ダイズの紫斑病 (Cercospora kikuchii)、黒とう病 (Elsinoe glycines)、黒
点病 (Diaporthe phaseololum)、
インゲンの炭そ病 (Colletotrichum lindemuthianum)、
ラッカセイの黒没病 (Mycosphaerella personatum)、褐斑病 (Cercospora arac

hidicola)、

エンドウのうどんこ病 (*Erysiphe pisi*)、

ジャガイモの夏疫病 (*Alternaria solani*)、

イチゴのうどんこ病 (*Sphaerotheca humuli*)、

チャの網もち病 (*Exobasidium reticulatum*)、白星病 (*Elsinoe leucospila*)

、タバコの赤星病 (*Alternaria longipes*)、うどんこ病 (*Erysiphe cichoracea rum*)、炭そ病 (*Colletotrichum tabacum*)、テンサイの褐斑病 (*Cercospora beticola*)、

バラの黒星病 (*Diplocarpon rosae*)、うどんこ病 (*Sphaerotheca pannosa*)、

キクの褐斑病 (*Septoria chrysanthemi-indici*)、白さび病 (*Puccinia horiana*)、

種々の作物の灰色かび病 (*Botrytis cinerea*)、種々の作物の菌核病 (*Sclerotinia sclerotiorum*) 等が挙げられる。

また、本発明化合物は、農園芸作物および樹木等を加害するいわゆる農業害虫、家畜家禽類に寄生するいわゆる家畜害虫、家屋等の人間の生活環境で様々な悪影響を与えるいわゆる衛生害虫、倉庫に貯蔵された穀物等を加害するいわゆる貯穀害虫、および同様の場面で発生加害するダニ類、線虫類、軟体動物、甲殻類のいずれの害虫も低濃度で有効に防除できる。

本発明化合物を用いて防除しうる昆虫類、ダニ類、線虫類、軟体動物、甲殻類には具体的には次に示すものがあるが、それらのみに限定されるものではない。

ニカメリガ (*Chilo suppressalis*)、コブノメリガ (*Cnaphalocrocis medinalis*)、フタオビコヤガ (*Nerenga aenescens*)、イチモンジセシリ (*Parnara guttata*)、コナガ (*Plutella xylostella*)、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*)、モンシロチョウ (*Pieris rapae crucivora*)、カブラヤガ (*Agrotis segetum*)、ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*)、シロイチモンジヨトウ (*Spodoptera exigua*)、オオタバコガ (*Helicoverpa armigera*)、チャノコカクモンハマキ (*Adoxophyes sp.*)、チャハマキ (*Homona magnanima*)、モモシンクイ (*Carposina nipponensis*)、ナシヒメシンクイ (*Grapholita molesta*)、リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana fasciata*)、キンモンホソガ (*Phyllonorycter ringon*

iella)、コットンポールワーム (*Helicoverpa zea*)、タバコバッドワーム (*Heliothis virescens*)、ヨーロピアンコーンボーラー (*Ostrinia nubialis*)、フォールアーミーワーム (*Spodoptera frugiperda*)、コドリンガ (*Cydia pomonella*) 及びアメリカシロヒトリ (*Hyphantria cunea*) などの鱗翅目害虫、ツマグロヨコバイ (*Nephrotettix cincticeps*)、トビイロウンカ (*Nilaparvata lugens*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*)、ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*)、オンシツコナジラミ (*Trialeurodes vaporariorum*)、シルバーリーフコナジラミ (*Bemisia tabaci*)、ナシキジラミ (*Psylla pyricola*)、ツツジグンバイ (*Stephanitis pyriodes*)、ヤノネカイガラムシ (*Unaspis yanensis*)、クワコナカイガラムシ (*Pseudococcus comstocki*)、ルビーロウムシ (*Ceroplastes rubens*)、オオワラジカイガラムシ (*Drosicha corpulenta*)、クサギカメムシ (*Halyomorpha mista*)、ナガメ (*Eurydema rugosam*) 及びナンキンムシ (*Cimex lectularis*) などの半翅目害虫、ニジュウヤホシテントウ (*Henosepilachna vigintioctopunctata*)、ドウガネブイブイ (*Anomala cuprea*)、マメコガネ (*Popilla japonica*)、イネミズゾウムシ (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、シバオサゾウムシ (*Sphenophorus venatus vestitus*)、アリモドキゾウムシ (*Cylas formicarius*)、ウリハムシ (*Aulacophora femoralis*)、キスジノミハムシ (*Phyllotreta striolata*)、コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata*)、ゴマダラカミキリ (*Anoplophora malasiaca*)、アオバアリガタハネカクシ (*Paederus fusceps*)、マツノマダラカミキリ (*Monochamus alternatus*)、カンシャコメツキ (*Melanotus tamsuyensis*)、ヒメヒラタケシキスイ (*Europea domina*)、コーンルートワーム (*Diabrotica spp.*)、ココクゾウ (*Sitophilus oryzae*)、グラナリーウィービル (*Sitophilus granarius*) 及びコクヌストモドキ (*Tribolium castaneum*) などの鞘翅目害虫、マメハモグリバエ (*Liriomyza trifoli*)、タネバエ (*Delia platura*)、ヘシアシフライ (*Mayetiola destructor*)、ウリミバエ (*Dacus (Zengodacus) cucurbitae*)、チチュウカイミバエ (*Ceratitis capitata*)、イエバエ (*Musca domestica*)、サシバエ (*Stomoxys calcitrans*)、ヒツジシラミバエ (*Melophagus orinus*)、キスジウシバエ (*Hypoderma lineatum*)、ウシバエ (*Hypoderma boris*)、

ヒツジバエ (*Oestrus ovis*)、ツエツツエバエ (*Golossina palpais*)、キアシオオブユ (*Prosimulium yezoensis*)、ウシアブ (*Tabanus trigonus*)、オオチヨウバエ (*Telmatoscopus albipunctatus*)、トクナガクロヌカカ (*Leptoconops nipponensis*)、アカイエカ (*Culex pipiens pallens*)、ネッタイシマカ (*Aedes aegypti*)、ヒトスジシマカ (*Aedes albopictus*) 及びシナハマダラカ (*Anopheles culicifacies*) などの双翅目害虫、

カブラハバチ (*Athalis rosae ruficornis*)、マツノキハバチ (*Neodiprion sexifer*)、クリハバチ (*Apethymus kuri*)、グンタイアリ、クロオオアリ (*Caponotus japonicus*)、オオスズメバチ (*Vespa mandarina*)、ブルドックアント、ファイヤーアント及びファラオアントなどの膜翅目害虫、

ミナミキイロアザミウマ (*Thrips palmi*)、ネギアザミウマ (*Thrips tabaci*)、ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*)、ヒラズハナアザミウマ (*Frankliniella intonsa*) 及びチャノキイロアザミウマ (*Scirtothrips dorsalis*) などの総翅目害虫、

クロゴキブリ (*Periplaneta fuliginosa*)、ヤマトゴキブリ (*Periplaneta japonica*) 及びチャバネゴキブリ (*Blattella germanica*) などの網翅目害虫、

ケラ (*Gryllotalpa africana*)、エンマコオロギ (*Teleogryllus emma*)、トノサマバッタ (*Locusta migratoria*)、コバネイナゴ (*Oxya yezoensis*) 及びサバクワタリバッタ (*Schistocerca gregaria*) などの直翅目害虫、

イエシロアリ (*Coptotermes formosanus*)、ヤマトシロアリ (*Leucotermes spatus*) 及びタイワンシロアリ (*Odontotermes formosanus*) などのシロアリ目害虫、

ネコノミ (*Ctenocephalides felis*)、ヒトノミ (*Pulex irritans*) 及びケオブスネズミノミ (*Xenopsylla cheopis*) などの等翅目害虫、

ニワトリオオハジラミ (*Menacanthus stramineus*) 及びウシハジラミ (*Bovicola bovis*) などのハジラミ目害虫、

ウシジラミ (*Haematopinus eurysternus*)、ブタジラミ (*Haematopinus suis*)、ウシホソジラミ (*Linognathus vituli*) 及びケブカウシジラミ (*Solenopotes capillatus*) などのシラミ目害虫、

ヤマトシミ (*Ctenolepisma villosa*) などの総尾目害虫、
ヒラタチャタテ (*Liposcelis bostrychophilus*) などの噛虫目害虫、
ヤギシロトビムシ (*Onychiuras pseudarmatus yagii*) 及びシロトビムシ (*Onychiuridae*) などの粘管目害虫、
ミカンハダニ (*Panonychus citri*)、リンゴハダニ (*Panonychus ulmi*)、ナミ
ハダニ (*Tetranychus urticae*) 及びカンザワハダニ (*Tetranychus kanzawai*)
などのハダニ類、
ミカンサビダニ (*Aculops pelekassi*)、ニセナシサビダニ (*Epitrimerus pyri*)
、チューリップサビダニ (*Aceria tulipae*) 及びチャノナガサビダニ (*Acaphylla theae*) などのフシダニ類、
チャノホコリダニ (*Polyphagotarsonemus latus*) 及びシクラメンホコリダニな
どのホコリダニ類、
ケナガコナダニ (*Tyrophagus putrescetiae*) 及びロビンネダニ (*Rhizoglyphus robini*) などのコナダニ類、
ミツバチヘギイタダニ (*Varroa jacobsoni*) などのハチダニ類、
オウシマダニ (*Boophilus microplus*) 及びフタトゲチマダニ (*Haemaphysalis longicornis*) などのマダニ類、
ヒツジキュウセンダニなどのキュウセンダニ類、
ヒゼンダニ (*Sarcaptes scabiei*) などのヒゼンダニ類、
トビズムカデ、アカズムカデ (*Sclopendra subspinipes japonica*)、ゲジ (*The reuronema hilgendorfi*) などの唇脚類、
ヤケヤスデ (*Oxidus gracilis*)、フジヤスデなどの倍脚類、
サツマイモネコブセンチュウ (*Meloidogyne incognita*)、キタネコブセンチュ
ウ (*Meloidogyne hapla*)、キタネグサレセンチュウ (*Pratylenchus penetrans*)
、クルミネグサレセンチュウ (*Pratylenchus vulnus*)、ジャガイモシストセ
ンチュウ (*Globodera rostochiensis*) 及びマツノザイセンチュウ (*Bursaphelen chus xylophilus*) などの線虫類、
スクミリンゴガイ (*Pomacea canaliculata*)、ナメクジ (*Incilaria pilineata*)
、アフリカマイマイ (*Achatina fulica*)、ウスカラマイマイ (*Acusta despecta*

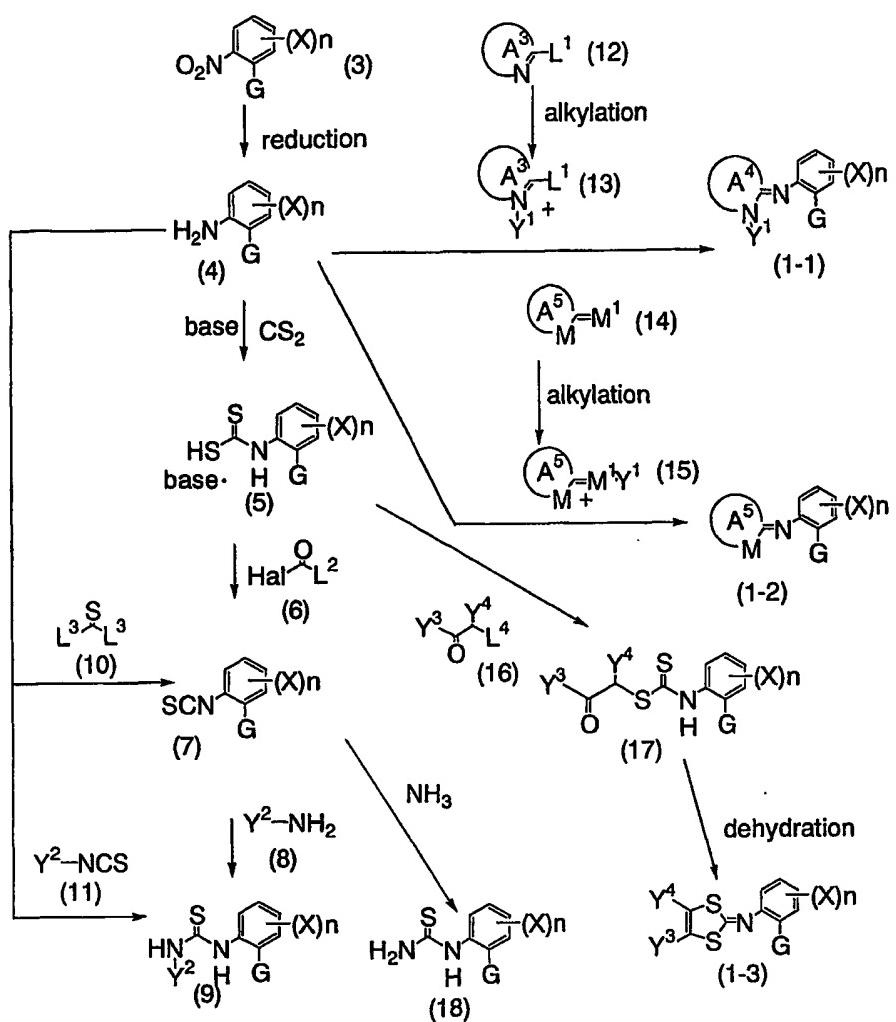
sieboldiana) 及びミスジマイマイ (*Euhadra peliomphala*) などの軟体動物、オカダンゴムシ (*Armadillidium vulgara latreille*) などの甲殻類があげられる。

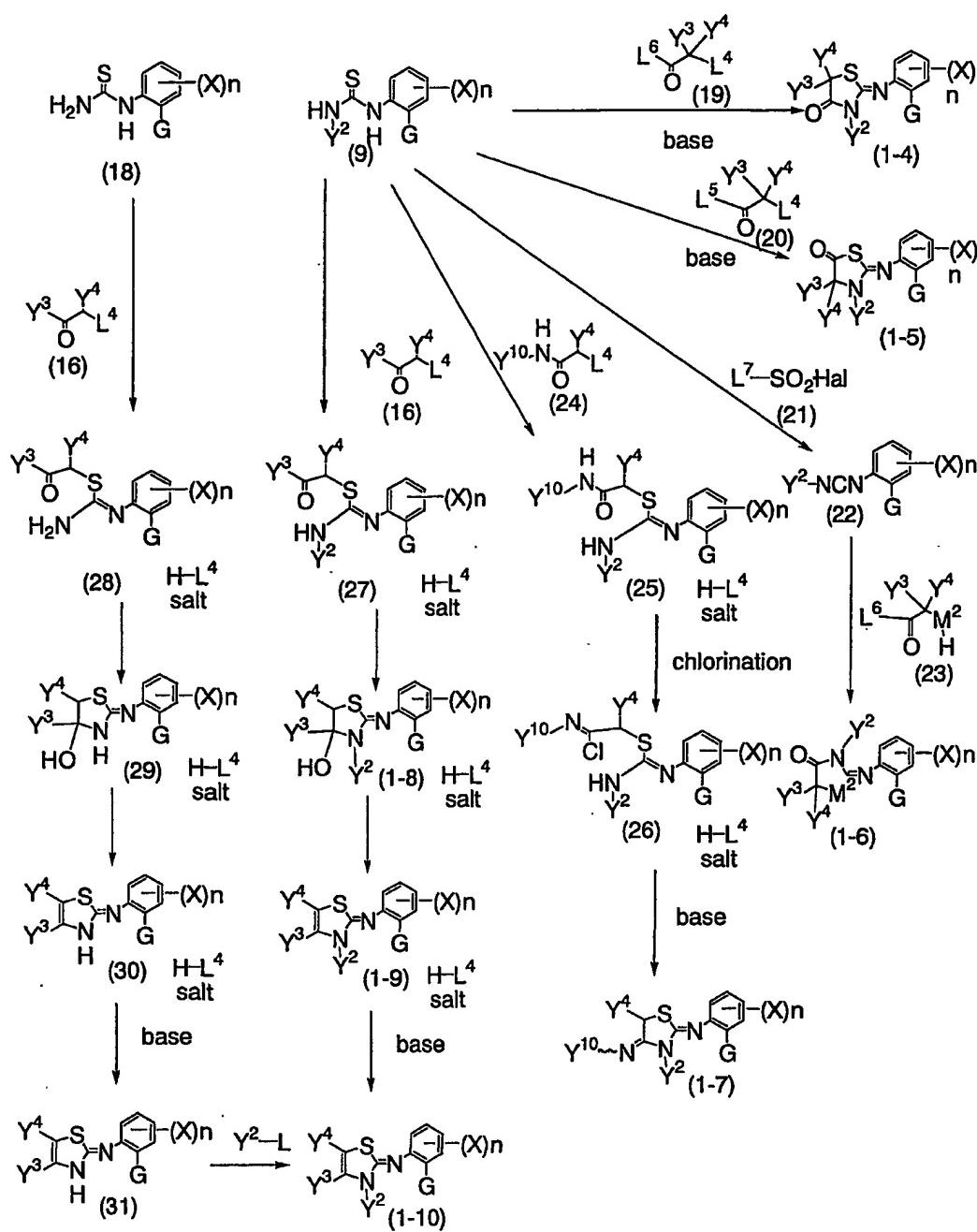
また、本発明化合物は極めて低い濃度で水中生物の付着防止に効果を示す。その水中生物としては、例えばムラサキイガイ、フジツボ、カキ、ヒドロムシ、ヒドラ、セルプラ、ホヤ、コケムシ、フサコケムシ、タニシ、アオサ、アオノリ、シオミドロ等の貝類及び藻類等があげられる。

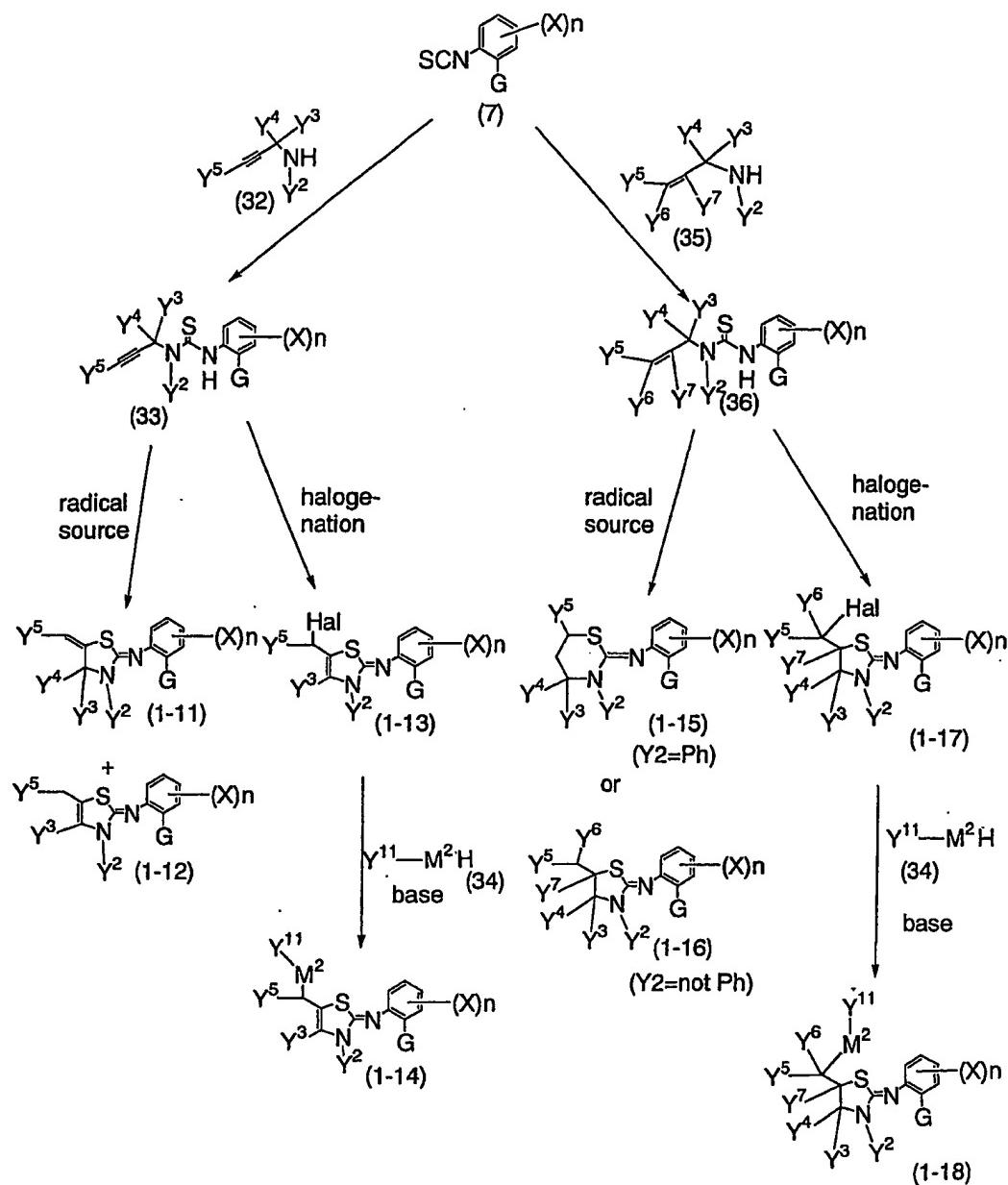
すなわち、本発明化合物は直翅目、半翅目、鱗翅目、鞘翅目、膜翅目、双翅目、シロアリ目およびダニ・シラミ類の害虫や植物病害を低濃度で有効に防除できる。更に、本発明化合物は海水及び淡水中における各種の水中生物の水中構築物等への付着を防除できる。一方、本発明化合物はホ乳類、魚類、甲殻類および益虫に対してほとんど悪影響がない極めて有用な化合物を含む。

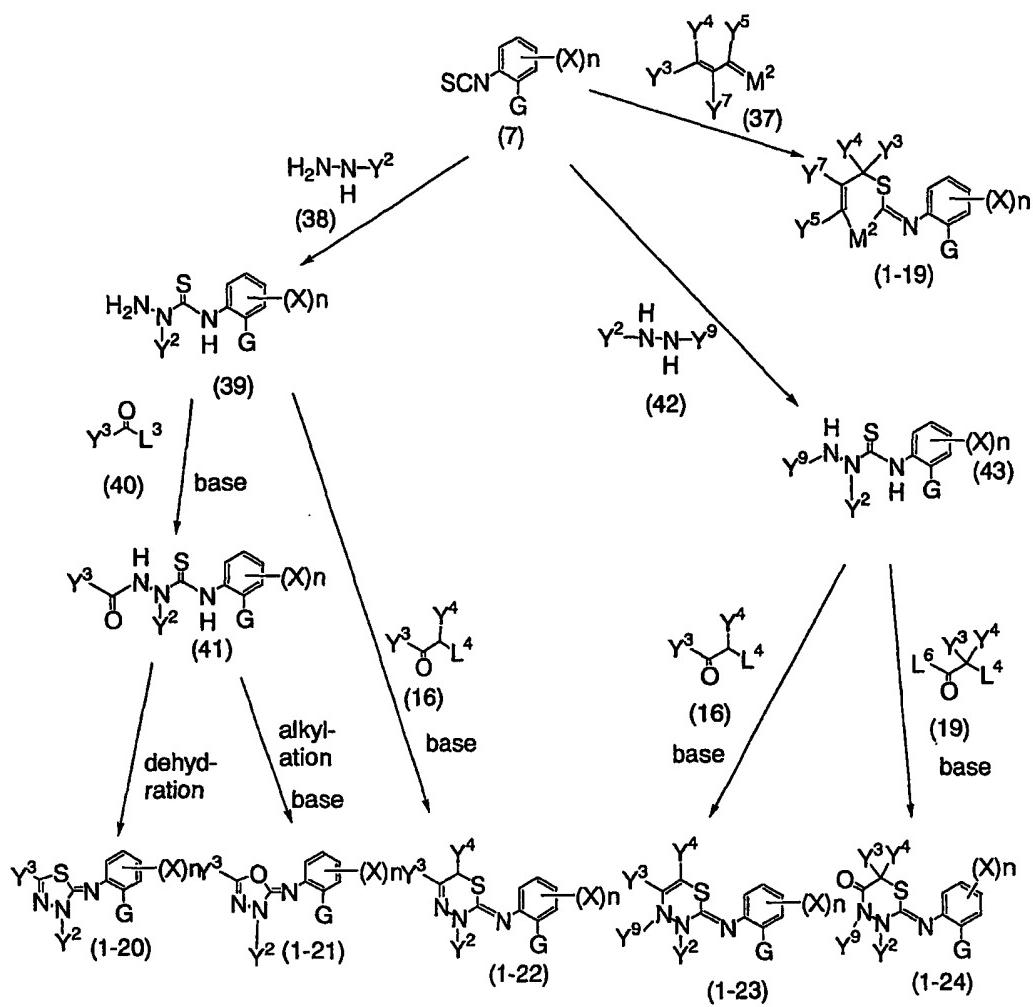
次に、前記（1）で表される本発明化合物の製造法を以下に説明する。

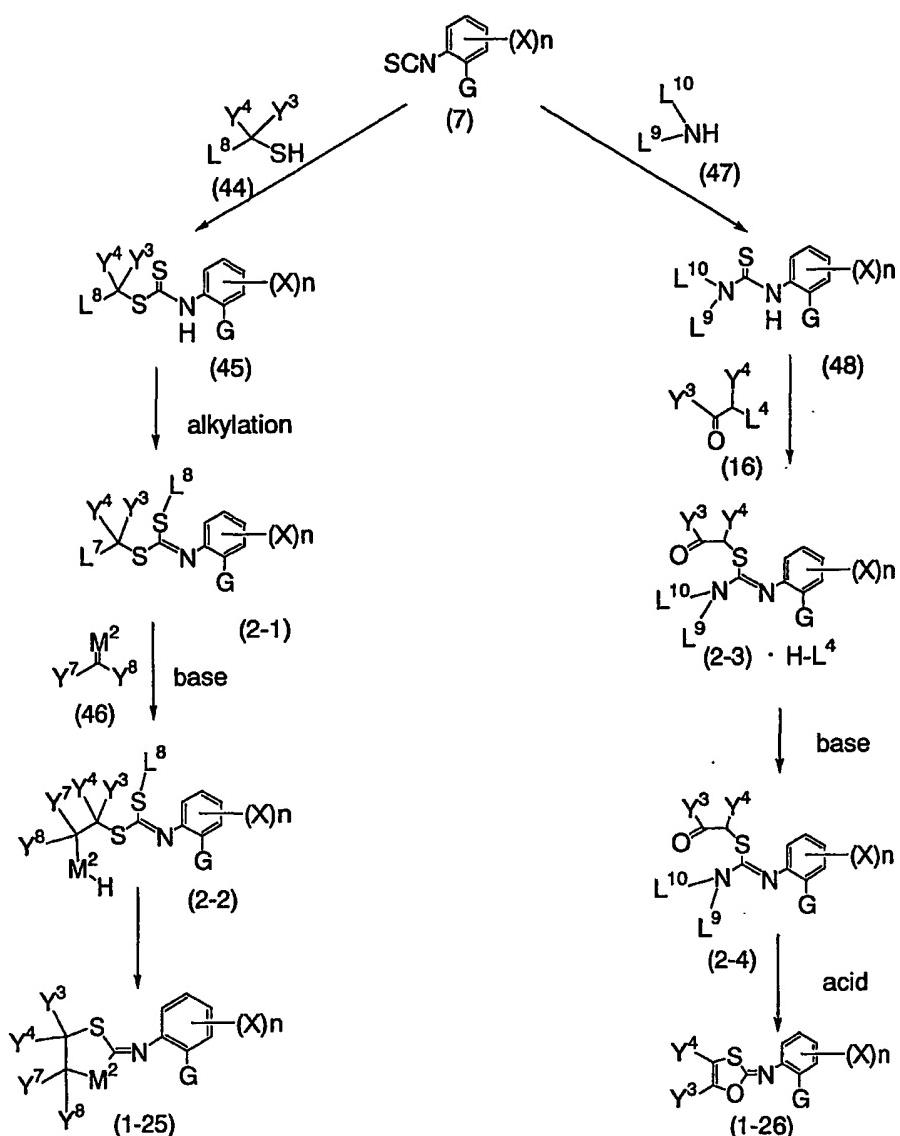
（製造法 1）











(A³およびA⁴は、各々独立に、前記Aと同様の意味を表し、但し、窒素原子を脱離基L¹またはイミノ結合のα位に有する環であり、A⁵は、前記Aと同様の意味を表し、但し、酸素原子、硫黄原子または窒素原子をC=M¹またはイミノ結合のα位に有する環である。Xおよびnは前述と同じ意味を表す。L¹は、良好な脱離基例えは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、炭素数1~4のアルコキシ、フェノキシ、炭素数1~4のアルキルアミノ、炭素数1~4のジアルキルアミノ、炭素数1~4のアルキルスルホニルオキシ、炭素数1~4のハロアルキルスルホニルオキシ、ベンゼンスルホニルオキシ、トルエンスルホニル

オキシ、1-ピラゾリルまたは1-イミダゾリル等である。 L^2 および L^6 は、良好な脱離基例えば、炭素数1～4のアルコキシ、炭素数1～4のアルキルチオ、フェノキシ、炭素数1～4のアルキルアミノ、炭素数1～4のジアルキルアミノ、1-ピラゾリルまたは1-イミダゾリル等である。 L^3 は、各々独立に、良好な脱離基例えば、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、炭素数1～4のアルコキシ、炭素数1～4のアルキルチオ、フェノキシ、炭素数1～4のアルキルアミノ、炭素数1～4のジアルキルアミノ、1-ピラゾリルまたは1-イミダゾリル等である。 L^4 は、良好な脱離基例えば、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、炭素数1～4のアルキルスルホニルオキシ、炭素数1～4のハロアルキルスルホニルオキシ、ベンゼンスルホニルオキシまたはトルエンスルホニルオキシ等である。 L^5 は、良好な脱離基例えば、塩素原子または臭素原子等である。 L^7 は、炭素数1～4のアルキル基、フェニルまたはトルイル基等である。 L^8 は、水素原子、トリメチルシリル基、ターシャリーブチルジメチルシリル基またはターシャリーブチルジフェニルシリル基等である。 L^9 および L^{10} は、各々独立に、Yと同じ意味を表すかまたは一緒になって、1-イミダゾリル、1-ピラゾリル、1-ピペリジニルまたはモルホリノを表す。Y¹は、炭素数1～6のアルキル基またはR^aで置換されていてもよいベンジル基を表す。Y²、Y⁹およびY¹⁰は、各々独立に、Yと同じ意味を表す。Y³、Y⁴、Y⁷、Y⁸およびY¹¹は、各々独立に、水素原子かまたは、Yと同じ意味を表す。Y⁵およびY⁶は、各々独立に、水素原子、炭素数1～6のアルキル基またはR^aで置換されていてもよいフェニル基を表す。Mは、酸素原子、硫黄原子またはN-Y²を表す。M¹は、酸素原子または硫黄原子を表す。M²は、酸素原子、硫黄原子またはN-Y⁹を表す。Halは、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子またはフッ素原子を表す。R^aは、前述と同じ意味を表す。Gは、前述と同じ意味を表す。)

ニトロ化合物(3)から式(9)で表される化合物を製造する方法としては、ヨーロッパ特許出願公報(E P - 4 4 7 1 1 8号公報)、オーガニック・ファンクショナル・グループ・プリパレイションズ(Organic Functional Group Preparations)(Academic社)第1巻、313頁(1968年)、ジャーナル・オブ・ザ・アメリカン・ケミカル・

ソサエティー (J. Am. Chem. Soc.) 第 54 卷、781 頁 (1932 年)、ケミカル・レビュー (Chem. Rev.) 第 55 卷、181 頁 (1955 年) 等に記載の方法を用いることができる。すなわち、ニトロ化合物 (3) の還元反応によりアミノ化合物 (4) へと変換した後、塩基存在下、二硫化炭素と反応させることにより、ジチオカルバミン酸化合物 (5) へと変換し、さらに、ジチオカルバミン酸化合物 (5) を、式 (6) で表される酸ハライド化合物と反応させることにより、イソチオシアネート化合物 (7) へと変換した後、イソチオシアネート化合物 (7) を式 (8) で表されるアミン化合物と反応させることで、チオウレア化合物 (9) を製造することが出来る。このとき、アミン化合物として、アンモニアを用いることで、同様にチオウレア化合物 (18) を製造することもできる。また、イソチオシアネート化合物 (7) は、アミノ化合物 (4) を式 (10) で表されるチオカルボニル化合物と反応させるといった方法によっても製造することが出来る。また、チオウレア化合物 (9) はアミノ化合物 (4) と式 (11) で表されるイソチオシアネート化合物と反応させるといった方法によっても製造することが出来る。さらに、チオウレア化合物 (9) は、シンセティク・コミュニケーション (Synth. Commun.) 第 25 卷 1 号、43 頁 (1995 年) に記載の方法を用いて、スルホン酸ハライド化合物 (21) と反応させることにより、カルボジイミド化合物 (22) へと変換することができる。

本発明化合物 (1-1) および (1-2) は、アミノ化合物 (4) を原料にアンゲバンテ・シェミー (Angew. Chem.) 第 80 卷、799 頁 (1968 年) に記載の方法あるいはその方法に準じて製造することが出来る。すなわち本発明化合物 (1-1) は、予め式 (12) で表される化合物をアルキル化し式 (13) で表されるアンモニウム塩としたものを、必要に応じて溶媒中、場合によつては触媒存在下、アミノ化合物 (4) と反応させることにより製造できる。同様に、本発明化合物 (1-2) は、予め式 (14) で表される化合物をアルキル化し式 (15) で表されるオキソニウム塩またはチオキソニウム塩としたものを、必要に応じて溶媒中、場合によつては触媒存在下、アミノ化合物 (4) と反応させることにより製造できる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例

えば、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等が挙げられる。アルキル化剤としては、例えば、ヨウ化メチル、ヨウ化エチル、ベンジルプロミド等のアルキルハライド類、ジメチル硫酸、ジエチル硫酸、トリフルオロメタンスルホン酸メチルエステル等のスルホン酸エステル類、トリメチルオキソニウムテトラフルオロホウ酸塩、トリエチルオキソニウムテトラフルオロホウ酸塩等のトリアルキルオキソニウム塩等が挙げられ、好ましくは、トリメチルオキソニウムテトラフルオロホウ酸塩等が挙げられる。触媒としては、例えば、酸化銀、トリフルオロメタンスルホン酸銀塩等が挙げられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から300時間の範囲で行うことができ、1時間から168時間の範囲が好ましい。アルキル化剤の当量としては、(12)または(14)に対して、0.5から5.0当量の範囲で用いることができ、1から2.0当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(13)または(15)は(4)に対して、0.5から5.0当量の範囲で用いることができ、1から2.0当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-3)は、ジチオカルバミン酸化合物(5)と式(16)で表されるケトン化合物とを、必要に応じて溶媒中、場合によっては塩基存在下、場合によっては触媒存在下反応させることによってジチオカルバミン酸エステル化合物(17)へと変換した後、さらに必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、脱水剤と反応させることによって製造できる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N

－メチルピロリドン、N, N'－ジメチルイミダゾリジノン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。脱水剤としては、濃硫酸、ジシクロヘキシリカルボジイミド、五塩化リンまたはオキシ塩化リン等が用いられる。また、濃硫酸を溶媒として用いることもできる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(5)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、0.1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(16)は(5)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。脱水剤の当量としては、(17)に対して、0.1から100当量の範囲で用いることができ、1から50当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-4)は、チオウレア化合物(9)と式(19)で表されるカルボニル化合物とを、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によつては触媒存在下反応させることによって製造できる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂

肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、エタノール、テトラヒドロフラン、クロロホルム、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-*N*-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(9)に対して、0.1から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(19)は(9)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-5)は、チオウレア化合物(9)と式(20)で表される酸ハロゲン化合物とを、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によつては触媒存在下反応させることによって製造できる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、クロロホルム、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機

塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-*N*-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(9)に対して、0.1から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(20)は(9)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-6)は、カルボジイミド化合物(22)を必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、カルボニル化合物(23)と反応させることによって製造することができる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくはジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-*N*-ブチルアンモニウムブロミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(22)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(23)

は(22)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-7)は、チオウレア化合物(9)と式(24)で表されるアミド化合物とを反応させることにより得られる。すなわち、チオウレア化合物(9)と式(24)で表されるアミド化合物とを必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、反応させることによってプロイドチオウレア化合物(25)へと変換できる。さらに、プロイドチオウレア化合物(25)は、必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、ハロゲン化剤により処理することによって、イミドイルクロライド化合物(26)へと変換できる。さらに(26)は、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることにより、本発明化合物(1-7)へと変換できる。また、(25)とハロゲン化剤との反応で、塩基を用いることにより、(26)を単離することなく、(1-7)を得ることもできる。(9)から(25)を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、エタノール、テトラヒドロフラン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、酢酸エチル、アセトン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド、水等が挙げられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。基質の当量としては、(24)は(9)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。(25)から(26)を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であれ

ばよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン、N, N'-ジメチルイミダゾリジノン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等が挙げられる。ハロゲン化剤としては、テトラクロロエタン/トリフェニルホスフィン、オキシ塩化リン、5 塩化リン、3 塩化リン、シュウ酸ジクロライド、塩素、N-クロロこはく酸イミド等が挙げられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5 分から 100 時間の範囲で行うことができ、1 時間から 48 時間の範囲が好ましい。塩素化剤の当量としては、(25) に対して、0.01から 50 当量の範囲で用いることができ、0.1 から 20 当量の範囲が好ましい。(26) から (1-7) を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン、N, N'-ジメチルイミダゾリジノン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナ

トリウム等の無機塩基が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(26)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、0.1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-10)は、チオウレア化合物(9)と式(16)で表されるケトン化合物とを反応させることにより得られる。すなわち、チオウレア化合物(9)と式(16)で表されるケトン化合物とを必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、反応させることによってプソイドチオウレア化合物(27)へと変換できる。さらに、プソイドチオウレア化合物(27)は、必要に応じて溶媒中、酸あるいは塩基性触媒存在下、反応させることにより、ヒドロキシチアゾリジン化合物(1-8)へと変換できる。さらに(1-8)は、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、脱水剤で処理することにより、本発明化合物(1-9)へと変換できる。さらに、(1-9)は、必要に応じて溶媒中、塩基で処理することにより、遊離の化合物(1-10)へと変換できる。また、(9)と(16)との反応で、長時間、あるいは加熱処理あるいは触媒を用いて処理することにより、(27)または(1-8)を単離することなく(1-9)を得ることもできる。また、(9)と(16)との反応で、塩基を用いることにより、(27)または(1-8)または(1-9)を単離することなく、(1-10)を得ることもできる。また、(1-8)と脱水剤との反応で、塩基を用いることにより、(1-9)を単離することなく、(1-10)を得ることもできる。また、チオウレア化合物(18)から同様に得られるチアゾリジン化合物(31)を必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下アルキル化剤で処理することによっても得られる。(9)から(1-8)を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセ

トン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、エタノール、テトラヒドロフラン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、酢酸エチル、アセトン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド、水等が挙げられる。酸性触媒としては、塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、フッ化水素酸、酢酸、テトラフルオロほう酸等が挙げられる。塩基性触媒としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。基質の当量としては、(16)は(9)に対して、0.5から5.0当量の範囲で用いることができ、1から2.0当量の範囲が好ましい。ヒドロキシチアゾリジン化合物(1-8)から本発明化合物(1-9)を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン、N, N'-ジメチルイミダゾリジノン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナト

リウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。また、ピリジン等を溶媒として用いることもできる。触媒としては、例えば、テトラ-*N*-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。脱水剤としては、メタンスルホニルクロライド、トルエンスルホニルクロライド、トリフルオロメタンスルホン酸無水物、濃硫酸、ジシクロヘキシリカルボジイミド、五塩化リンまたはオキシ塩化リン等が用いられる。また、濃硫酸を溶媒として用いることもできる。また、トルエン、ベンゼン、キシレン等の溶媒を用いて、共沸脱水により反応させることもできる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(1-8)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、0.1から20当量の範囲が好ましい。脱水剤の当量としては、(1-8)に対して、0.1から100当量の範囲で用いることができ、1から50当量の範囲が好ましい。(1-9)から(1-10)を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン、N,N'-ジメチルイミダゾリジノン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ

、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(1-9)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、0.1から20当量の範囲が好ましい。(31)から(1-10)を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン、N,N'-ジメチルイミダゾリジノン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。アルキル化剤としては、例えば、ヨウ化メチル、ヨウ化エチル、ベンジルプロミド等のアルキルハライド類、ジメチル硫酸、ジエチル硫酸、トリフルオロメタンスルホン酸メチルエステル等のスルホン酸エステル類、トリメチルオキソニウムテトラフルオロホウ酸塩、トリエチルオキソニウムテトラフルオロホウ酸塩等のトリアルキルオキソニウム塩等が挙げられ、好ましくは、トリフルオロメタンスルホン酸メチルエステル等が挙げられる。反応温度は、-80°Cから溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0°Cから溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(31)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、0.1から20当量の範囲が好ましい。アルキル化剤の当量としては、(31)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、0.1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-11)および(1-12)は、以下のような方法により製造できる。すなわち、イソチオシアネート化合物(7)と式(32)で表される

プロパルギルアミン化合物とを、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることによって式（33）で表されるプロパルギルチオウレア化合物へ変換できる。さらに、（33）は、必要に応じて溶媒中、ラジカル発生剤で処理することにより、（1-11）と（1-12）の混合物を得ることができる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくはテトラヒドロフラン、クロロホルム、アセトン、アセトニトリル等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ビリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。ラジカル発生剤としては、トリフルオロ酢酸、酸素、空気、過酸化ベンゾイル、アソビスイソブチロニトリル等が用いられる。また、トリフルオロ酢酸を溶媒として用いることもできる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、（7）に対して、0.05から150当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、（32）は（7）に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物（1-13）は、前述のプロパルギルチオウレア化合物（33）を必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、

ハロゲン化剤で処理することにより製造できる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトニトリル等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。ハロゲン化剤としては、ヨウ素、臭素、N-ブロモコハク酸イミド、N-クロロコハク酸イミド、N-ヨードコハク酸イミド、テトラブチルアンモニウムトリブロマイド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(33)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。ハロゲン化剤の当量としては、(33)に対して0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-14)は、前述の(1-13)と式(34)で表されるアミン化合物、アルコール化合物またはメルカプタン化合物とを必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることにより得られる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジ

メトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトニトリル等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、ジアザビシクロウンデセン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基やフッ化セシウム、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(1-13)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(34)は(1-13)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-15)および(1-16)は、以下のような方法により製造できる。すなわち、イソチオシアネート化合物(7)と式(35)で表されるアリルアミン化合物とを、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることによって式(36)で表されるアリルチオウレア化合物へ変換できる。さらに、(36)は、必要に応じて溶媒中、ラジカル発生剤で処理することにより、Y²がフェニルの場合は本発明化合物(1-15)を、Y²がフェニル以外の場合は本発明化合物(1-16)をそれぞれ得ることができる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン

、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1，2-ジクロロエタン等のハログン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ベンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、クロロホルム、アセトン、アセトニトリル等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。ラジカル発生剤としては、トリフルオロ酢酸、酸素、空気、過酸化ベンゾイル、アソビスイソブチロニトリル等が用いられる。また、トリフルオロ酢酸を溶媒として用いることもできる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(7)に対して、0.05から150当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(35)は(7)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-17)は、前述のアリルチオウレア化合物(36)を必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、ハログン化剤で処理することにより製造できる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1，2-ジクロロエタン等のハログン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等の

ニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトニトリル等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリプチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。ハロゲン化剤としては、ヨウ素、臭素、N-ブロモコハク酸イミド、N-クロロコハク酸イミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(36)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。ハロゲン化剤の当量としては、(36)に対して0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-18)は、前述の(1-17)と式(34)で表されるアミン化合物、アルコール化合物またはメルカプタン化合物とを必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることにより得られる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラ

ン、ベンゼン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトニトリル等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、ジアザビシクロウンデセン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基やフッ化セシウム、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(1-17)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(34)は(1-17)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-19)は、シンセシス(Synthesis)896頁(1981年)記載の方法あるいはその方法に準じて製造できる。すなわち、イソチオシアネート化合物(7)と式(37)で表されるオレフィン化合物とを必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることにより得られる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトニトリル等が挙げられる。塩基の当量としては、(7)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。触媒とし

ては、例えば、テトラ-*N*-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(7)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(37)は(7)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-20)は、西ドイツ特許出願公報(DE-3025559号公報)記載の方法あるいはその方法に準じて、製造することができる。すなわち、イソチオシアネート化合物(7)と式(38)で表されるヒドラジン化合物とを必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、反応させることにより、チオセミカルバジド化合物(39)へ変換できる。さらに式(40)で表されるカルボニル化合物と必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては、触媒存在下、反応させることで、アシルチオセミカルバジド化合物(41)へと変換することができる。さらに、アシルチオセミカルバジド化合物(41)を必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、脱水剤で処理することにより、本発明化合物(1-20)を得ることができる。

イソチオシアネート化合物(7)から、チオセミカルバジド化合物(39)を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類またはジメチルスルホキシドあるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、アセトン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。触媒としては、例えば、テトラ-*N*-ブチルア

ンモニウムプロミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。基質の当量としては、(38)は(7)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

チオセミカルバジド化合物(39)からアシルチオセミカルバジド化合物(41)へ変換する反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類またはジメチルスルホキシドあるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、アセトン、アセトニトリル、ジメチルアセトアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、ジアザビシクロウンデセン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基やフッ化セシウム、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(39)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。基質の当量としては、(40)は(39)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

アシルチオセミカルバジド化合物(41)から、本発明化合物(1-20)を得

る反応においては、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類またはジメチルスルホキシドあるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ベンゼン、キシレン、クロロホルム等が挙げられる。触媒としては、例えば、テトラ-*N*-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。脱水剤としては、濃硫酸、ジシクロヘキシカルボジイミド、5-塩化リンまたはオキシ塩化リン等が用いられる。また、濃硫酸を溶媒として用いることもできる。反応温度は、-80°Cから溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0°Cから溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。脱水剤の当量としては、脱水剤は(41)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-21)は、西ドイツ特許出願公報(DE-3025559号公報)記載の方法あるいはその方法に準じて、製造することができる。すなわち前述のアシリチオセミカルバジド化合物(41)を、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下アルキル化剤と反応させることによって、得ることができる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチ

ルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、エタノール、テトラヒドロフラン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、ジメチルアセトアミド等が挙げられる。アルキル化剤としては、例えば、ヨウ化メチル、ヨウ化エチル、ベンジルプロミド等のアルキルハライド類、ジメチル硫酸、ジエチル硫酸、トリフルオロメタンスルホン酸メチルエステル等のスルホン酸エステル類、トリメチルオキソニウムテトラフルオロホウ酸塩、トリエチルオキソニウムテトラフルオロホウ酸塩等のトリアルキルオキソニウム塩等が挙げられる。触媒としては、例えば、テトラ-*N*-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。アルキル化剤の当量としては、アルキル化剤は(41)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-22)は、前述のチオセミカルバジド化合物(39)と式(16)で表されるケトン化合物とを、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることによって得られる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、エタノール、テトラヒドロフラン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナト

リウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-*N*-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(39)に対して、0.05から150当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(16)は(39)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-23)は、イソチオシアネート化合物(7)と式(42)で表されるヒドラジン化合物とを必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、反応させることにより、チオセミカルバジド化合物(43)へ変換した後、さらに必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、式(16)で表されるケトン化合物と反応させることによって得られる。イソチオシアネート化合物(7)から、チオセミカルバジド化合物(43)を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類またはジメチルスルホキシドあるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、エタノール、テトラヒドロフラン、クロロホルム、アセトニトリル等が挙げられる。触媒としては、例えば、テトラ-*N*-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。基質の当量としては、(42)は(7)に

対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。チオセミカルバジド化合物(43)から本発明化合物(1-23)を得る反応においては、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、クロロホルム、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(43)に対して、0.05から150当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(16)は(43)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-24)は前述のチオセミカルバジド化合物(43)と式(19)で表されるカルボニル化合物とを必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下反応させることによって製造できる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等の

エーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、エタノール、テトラヒドロフラン、クロロホルム、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(43)に対して、0.1から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(19)は(43)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1-25)はヘテロサイクルス(Heterocycles)第50巻、195頁(1999年)記載の方法あるいはその方法に準じて製造できる。すなわち、イソチオシアネート化合物(7)と式(44)で表されるメルカプタン化合物とを必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることにより、ジチオカルバミン酸エステル化合物(45)とした後、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、アルキル化剤で処理することにより、ジチオアセタール化合物(2-1)へと変換できる。さらにジチオアセタール化合物(2-1)と式(46)で表されるカルボニル化合物とを必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることにより(2-2)および(1-

25) の混合物が得られる。また、(7) から (2-1) の反応では、(45) を単離することなく (2-1) を得ることもできる。また、(2-1) から (1-25) の反応では、長時間あるいは、加熱することにより (2-2) を単離することなく (1-25) を得ることもできる。また、単離した (2-2) を必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させるかまたは加熱処理することにより、(1-25) へ変換することもできる。

(7) から (2-1) への反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトン、アセトニトリル、ジメチルアセトアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、ジアザビシクロウンデセン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。アルキル化剤としては、例えば、ヨウ化メチル、ヨウ化エチル、ベンジルプロミド等のアルキルハライド類、ジメチル硫酸、ジエチル硫酸、トリフルオロメタンスルホン酸メチルエステル等のスルホン酸エステル類、トリメチルオキソニウムテトラフルオロホウ酸塩、トリエチルオキソニウムテトラフルオロホウ酸塩等のトリアルキルオキソニウム塩等が挙げられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、

1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(7)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、(45)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。基質の当量としては、(44)は(7)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。またアルキル化剤は(45)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

(2-1)から(1-25)への反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類またはジメチルスルホキシドあるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、キシレン、トルエン等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、ジアザビシクロウンデセン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基やフッ化セシウム、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。反応温度は、-80°Cから溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0°Cから溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(2-1)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。基質の当量としては、(46)は(2-1)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

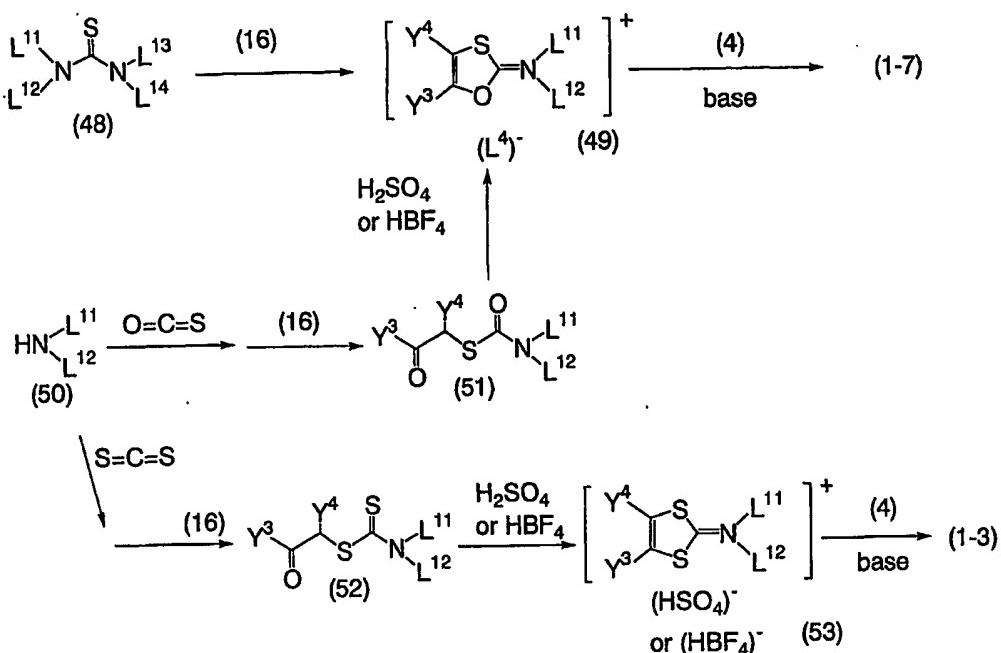
本発明化合物（1-26）は、特開昭55-108869およびケミストリー・レターズ（Chemistry Letters）1705頁（1988年）記載の方法あるいはその方法に準じて、製造できる。すなわち、イソチオシアネート化合物（7）と式（47）で表されるアミン化合物とを、必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、反応させることによって、チオウレア化合物（48）へ変換できる。さらに、チオウレア化合物（48）は、式（16）で表されるケトン化合物と必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることによりプロトイドチオウレア化合物（2-3）へと変換できる、さらに（2-3）は、必要に応じて溶媒中、塩基で処理することにより遊離の化合物（2-4）に変換できる。さらに、（2-4）は、必要に応じて溶媒中、酸で処理することにより、本発明化合物（1-26）に変換できる。また、チオウレア化合物（48）とケトン類（16）との反応で、塩基を過剰に用いることにより、（2-3）を単離することなく、（2-4）を得ることもできる。また、チオウレア化合物（48）とケトン類（16）との反応で、長時間あるいは、加熱処理することにより、（2-3）および（2-4）を単離することなく（1-26）を得ることもできる。イソチオシアネート化合物（7）から、チオウレア化合物（48）を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類またはジメチルスルホキシドあるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、酢酸エチル、アセトニトリル、ジメチルアセトアミド等が挙げられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点

の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。基質の当量としては、(47)は(7)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。チオウレア化合物(48)から本発明化合物(1-26)を得る反応においては、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン、ジオキサン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、アセトン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド、ジオキサン等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。反応温度は、-80°Cから溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0°Cから溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(48)に対して、0.05から150当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の量の範囲で用いることができ、(16)は(48)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

(製造法2)

前記(1)のAがジチオレン環またはオキサチオレン環で表される本発明化合物(1-7)および(1-3)は、(製造法1)で示した方法のほか、以下に示す

すような方法によっても合成できる。



(L^4 、 Y^3 および Y^4 は前述と同じ意味を表す。 (4)、(16)、(1-7) および(1-3) は前述と同じものを表す。 L^{11} 、 L^{12} 、 L^{13} および L^{14} は、各々独立に、 C_1-C_4 アルキルを表すかまたは、 L^{11} と L^{12} または L^{13} と L^{14} とが一緒になって、ピペラジン環、モルホリン環、ピロリジン環、イミダゾール環、ピラゾール環またはピペリジン環を表す。)

すなわち、テトラアルキルチオウレア (48) とケトン化合物 (16) とを必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、反応させることによりオキサチオレンイミニウム塩 (49) とすることが出来る。さらに、得られた (49) をアミノ化合物 (4) と反応させることにより、本発明化合物 (1-7) を得ることが出来る。

テトラアルキルチオウレア (48) からオキサチオレンイミニウム塩 (49) を得る反応においては、溶媒としては、反応に不活性であれば良く、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン、ジオキサン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチ

ル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類またはペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。反応温度は、-80°Cから溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0°Cから溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。基質の当量としては、(16)は(48)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。オキサチオレンイミニウム塩(49)から本発明化合物(1-7)を得る反応においては、溶媒としては、反応に不活性であれば良く、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン、ジオキサン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類またはペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。また、ピリジン等を溶媒として用いることもできる。反応温度は、-80°Cから溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0°Cから溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当

量としては、塩基は(49)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。基質の当量としては、(4)は(49)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

また、オキサチオレンイミニウム塩(49)は、アミン化合物(50)を硫化カルボニルおよびケトン化合物(16)で順次処理することにより、チオカーバメート化合物(51)とした後、濃硫酸またはテトラフルオロホウ酸にて脱水することにより得ることもできる。

アミン化合物(50)からチオカーバメート化合物(51)を経てオキサチオレンイミニウム塩(52)を得る反応は、ケミカル・アンド・ファーマシューティカル・ブレティン(Chem. Pharm. Bull.)第20巻、304頁(1972年)に記載の方法あるいはその方法に準じて行うことができる。

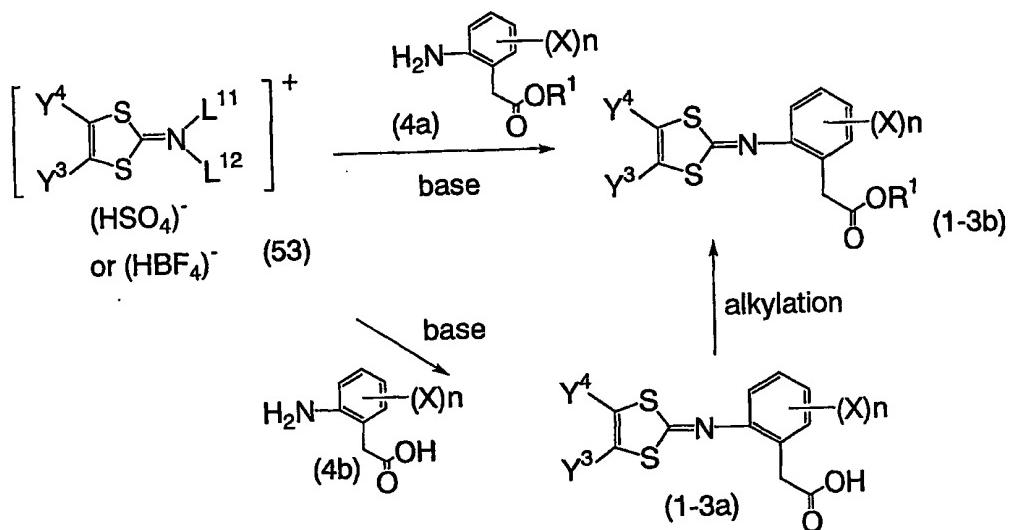
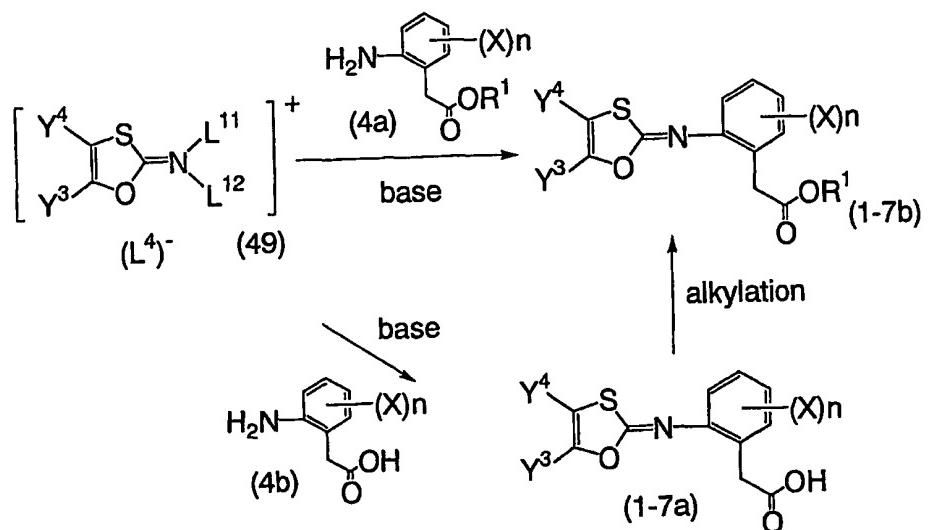
また、本発明化合物(1-3)は、アミン化合物(50)を二硫化炭素およびケトン化合物(16)で順次処理することにより、ジチオカーバメート化合物(52)とした後、濃硫酸またはテトラフルオロホウ酸にて脱水することにより、ジチオレンイミニウム塩(53)とすることが出来る。さらに、得られた(53)をアミノ化合物(4)と反応させることにより、本発明化合物(1-3)を得ることが出来る。

アミン化合物(50)からジチオカーバメート化合物(52)を経てジチオレンイミニウム塩(53)を得る反応は、ケミカル・アンド・ファーマシューティカル・ブレティン(Chem. Pharm. Bull.)第17巻、1924頁(1969年)、テトラヘドロン・レターズ(Tetrahedron Letters)1137頁(1971年)およびケミカル・アンド・ファーマシューティカル・ブレティン(Chem. Pharm. Bull.)第20巻、171頁(1972年)に記載の方法あるいはその方法に準じて行うことができる。ジチオレンイミニウム塩(53)から本発明化合物(1-3)を得る反応においては、溶媒としては、反応に不活性であれば良く、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン、ジオキサン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、

1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類またはペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。また、ピリジン等を溶媒として用いることもできる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、塩基は(53)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。基質の当量としては、(4)は(53)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

(製造法3)

また、前記(1)のAがジチオレン環またはオキサチオレン環であり、かつGが-CH₂C(=O)OR'で表される本発明化合物は、(製造法1)で示した方法のほか、以下に示すような方法によっても合成できる。



(X、n、R¹、Y³、Y⁴、L⁴、L¹¹およびL¹²は前述と同じ意味を表す。)

すなわち、本発明化合物（1-7b）は、（製造法2）により得られたオキサチオレンイミニウム塩（49）をアミノフェニル酢酸エステル化合物（4a）と反応させることにより得ることが出来る。また、（49）とアミノフェニル酢酸（4b）とを反応させ、いったん、イミノフェニル酢酸化合物（1-7a）とした後、エステル化することによっても得ることができる。

また、本発明化合物（1-3 b）は、上記の方法により得られたジチオレンイミニウム塩（53）をアミノフェニル酢酸エステル化合物（4a）と反応させることにより得ることが出来る。また、（53）とアミノフェニル酢酸（4b）とを反応させ、いったん、イミノフェニル酢酸化合物（1-3a）とした後、エステル化することによっても得ることができる。

オキサチオレンイミニウム塩（49）とアミノフェニル酢酸エステル化合物（4a）とから本発明化合物（1-7b）を得る反応、オキサチオレンイミニウム塩（49）とアミノフェニル酢酸化合物（4b）とからイミノフェニル酢酸化合物（1-7a）を得る反応、ジチオレンイミニウム塩（53）とアミノフェニル酢酸エステル化合物（4a）とから本発明化合物（1-3b）を得る反応およびジチオレンイミニウム塩（53）とアミノフェニル酢酸化合物（4b）とからイミノフェニル酢酸化合物（1-7a）を得る反応においては、それぞれ溶媒としては、反応に不活性であれば良く、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン、ジオキサン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類またはペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。また、ピリジン等を溶媒として用いることもできる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量

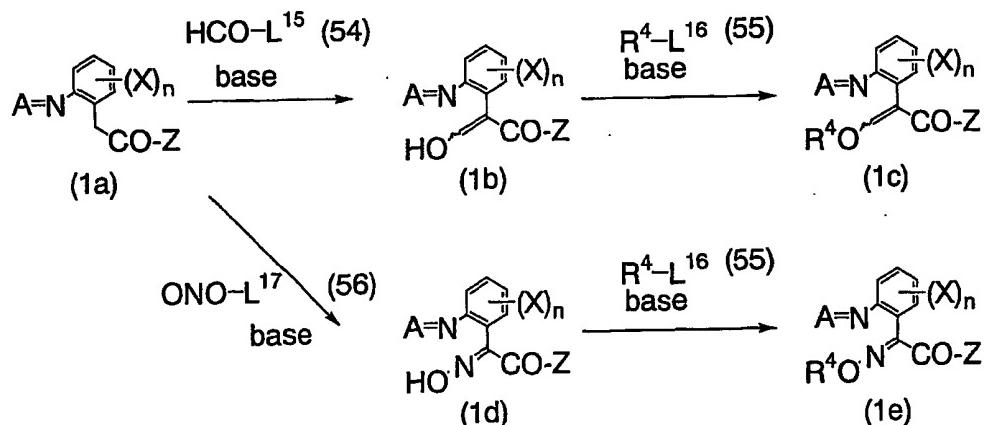
としては、塩基は（4 9）または（5 3）に対して、0. 5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。基質の当量としては、（4 a）はそれぞれ（4 9）および（5 3）に対して、0. 5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また（4 b）はそれぞれ（4 9）および（5 3）に対して、0. 5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

（1-7 a）から（1-7 b）を得る反応および（1-3 a）から（1-3 b）を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1、2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン、N, N'-ジメチルイミダゾリジノン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。アルキル化剤としては、例えば、ヨウ化メチル、メチルプロミド等のアルキルハライド類、ジメチル硫酸、トリフルオロメタンスルホン酸メチルエステル等のスルホン酸エster類、トリメチルオキソニウムテトラフルオロホウ酸塩等のトリアルキルオキソニウム塩等が挙げられ、好ましくは、ジメチル硫酸またはヨウ化メチル等が挙げられる。また、アルコール中脱水剤を用いて合成することも出来、脱水剤としては、濃硫酸、アザジカルボン酸ジエチル、トリフルオロメタンスルホン酸無水物、ジシクロヘキシルカルボジイミド、五塩化リンまたはオキシ塩化リン等が用いられる。また、トルエン、ベンゼン、キシレン等の溶媒を用いて、共沸脱水により反応させることもできる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行う

ことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(1-7a)または(1-3a)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、0.1から20当量の範囲が好ましい。アルキル化剤の当量としては、(1-7a)または(1-3a)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、0.1から20当量の範囲が好ましい。脱水剤の当量としては、(1-7a)または(1-3a)に対して、0.01から50当量の範囲で用いることができ、0.1から20当量の範囲が好ましい。

(製造法4)

前記(1)のGが $-C(=CH-OR^4)-C(=O)Z$ および $-C(=N-OR^4)-C(=O)Z$ で表される本発明化合物は、(製造法1)および(製造法2)に示した方法のほかに、(製造法1)および(製造法3)により得られた本発明化合物(1-1)から(1-26)、(1-3b)および(1-7b)に相当する(1a)で表されるヘテロイミノフェニル酢酸化合物を出発原料として、以下に示すような方法で製造することもできる。



(A, X, n, R⁴, Zは、前述と同じ意味を表す。L¹⁵は良好な脱離基例えれば、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、炭素数1~4のアルコキシ、フェノキシ、炭素数1~4のアルキルアミノ、炭素数1~4のジアルキルアミ

ノ、炭素数1～4のアルキルスルホニルオキシ、ベンゼンスルホニルオキシ、トルエンスルホニルオキシ、1-ピラゾリルまたは1-イミダゾリル等である。 L^{16} は良好な脱離基例えば、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、炭素数1～4のアルキルスルホニルオキシ、ベンゼンスルホニルオキシ、トルエンスルホニルオキシ等である。 L^{17} は、炭素数1～6のアルキルまたは、ナトリウム、カリウム等の無機塩を表す。)

すなわち、本発明化合物(1a)は、式(54)で表されるギ酸ハライド化合物、ギ酸エステル化合物またはギ酸アミド化合物と溶媒中、塩基存在下、場合によつては触媒存在下、反応させることにより本発明化合物(1b)に変換できる。さらに(1b)は、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によつては触媒存在下、式(55)で表されるアルキルハライドまたはアルキル硫酸エステル等と反応させることにより、本発明化合物(1c)に変換できる。また、(1a)から(1b)への反応では、塩基を過剰に用いて、(1b)を単離せずに直接(1c)を合成することもできる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1、2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1、2-ジクロロエタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピベリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うこ

とができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(1a)に対して、0.05から150当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(1a)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

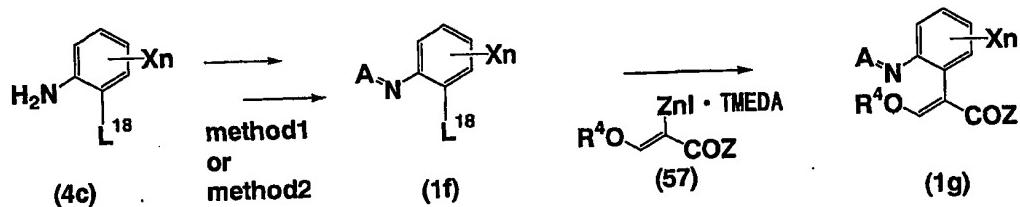
また、本発明化合物(1a)は、式(56)で表される亜硝酸エステル化合物または亜硝酸塩類と溶媒中、塩基存在下、場合によっては触媒存在下、反応させることにより本発明化合物(1d)に変換できる。さらに(1d)は、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、式(55)で表されるアルキルハライドまたはアルキル硫酸エ斯特ル等と反応させることにより、本発明化合物(1e)に変換できる。また、(1a)から(1e)への反応では、塩基を過剰に用いて、(1d)を単離せずに直接(1e)を合成することができる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1、2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエ斯特ル類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、トルエン、ジクロロエタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点

の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(1a)に対して、0.05から150当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(56)は(1a)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

。

(製造法5)

前記(1)のGが $-C(=CH-OR^4)-C(=O)Z$ で表される本発明化合物は、(製造法1)、(製造法2)および(製造法4)で示した方法のほかに、(製造法1)および(製造法2)における(4)の代わりに、アニリン化合物(4c)を出発原料として上記合成法と同様に本発明化合物(1-1)ないし(1-26)に相当するヘテロ環イミノフェニル化合物(1f)を合成した後、以下に示すような方法で製造することもできる。



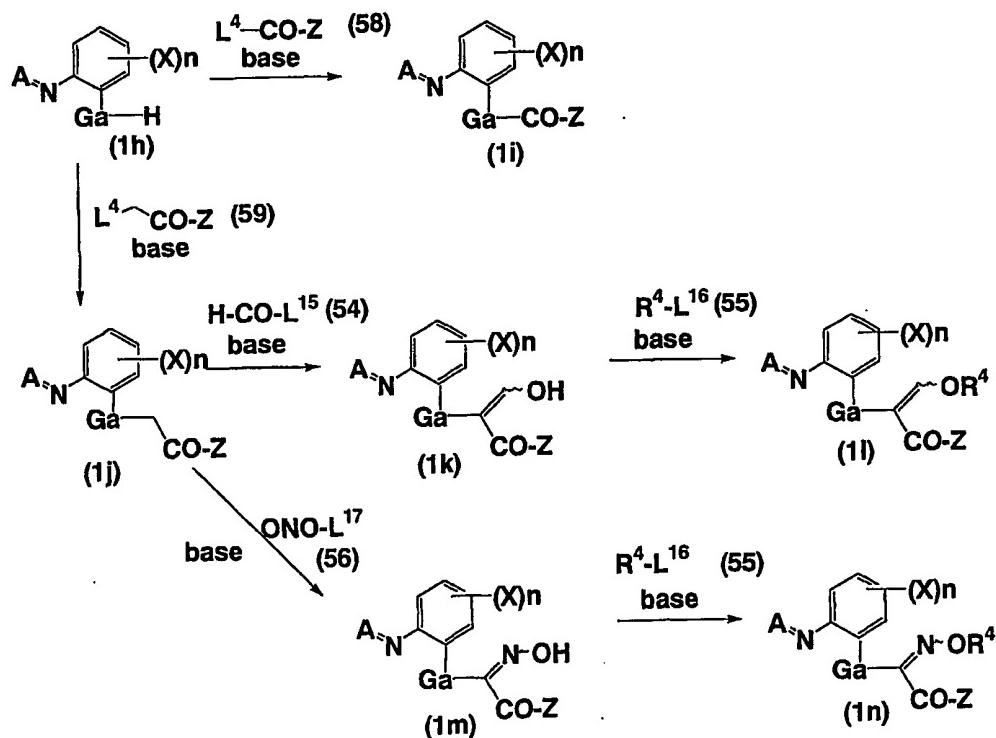
(A, X, n, Z, R⁴は前述と同じ意味を表す。L¹⁸は、良好な脱離基例えはフッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子、炭素数1~4のアルキルスルホニルオキシ、炭素数1~4のハロアルキルスルホニルオキシ、ベンゼンスルホニルオキシ、トルエンスルホニルオキシなどを表す。)

すなわち、テトラヘドロン(Tetrahedron)第54巻、7595頁(1998年)記載の方法あるいは、その方法に準じて(1f)とアクリル酸亜鉛錯体(57)とを反応させることにより合成することが出来る。

(製造法6)

また、Gが $-N(OR^4)-C(=O)Z$ 、 $-N(R^4)-C(=O)Z$ 、 $-O-C(=O)Z$ 、 $-S-C(=O)Z$ 、 $-N(OR^4)-CH_2-C(=O)Z$ 、

-N (R⁴) -CH₂-C (=O) Z、-O-CH₂-C (=O) Z、-S-CH₂-C (=O) Z、-N (OR⁴)-C (=CH-OR⁴)-C (=O) Z、-N (R⁴)-C (=CH-OR⁴)-C (=O) Z、-O-C (=CH-OR⁴)-C (=O) Z、-S-C (=CH-OR⁴)-C (=O) Z、-N (OR⁴)-C (=N-OR⁴)-C (=O) Z、-O-C (=N-OR⁴)-C (=O) Zまたは-S-C (=N-OR⁴)-C (=O) Zで表される本発明化合物は、(製造法1)および(製造法2)において示した方法のほかに、(製造法1)および(製造法2)におけるニトロ化合物(4)のGの代わりに、Ga-H (Gaは-O-, -NH-, -N (R⁴)-, -S-および-N (OR⁴)-を表す。)を有する化合物を出発原料とし、上記合成法と同様に(1-1)ないし(1-26)に相当するヘテロ環イミノフェニル化合物(1h)を合成した後、以下のように合成することもできる。すなわち、



(A、X、n、L⁴、L¹⁵、L¹⁶、L¹⁷、R⁴およびZは、前述と同じ意味を表し

、 G_a は、 -O-、 -N(R⁴) -、 -N(OR⁴) -、 -S- または -CH₂-N(R⁴) - を表す。)

すなわち本発明化合物 (1j) は、式 (1h) で表されるヘテロ環イミノフェニル化合物等を溶媒中、塩基存在下、場合によっては触媒存在下、カルボニル化合物 (58) と反応させることにより製造できる。溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピベリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(1h) に対して、0.05から150当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

また、本発明化合物 (1j) は、式 (59) で表されるハロ酢酸化合物等と溶媒中、塩基存在下、場合によっては触媒存在下、ヘテロ環イミノフェニル化合物 (1h) と反応させることにより製造できる。溶媒としては、反応に不活性であ

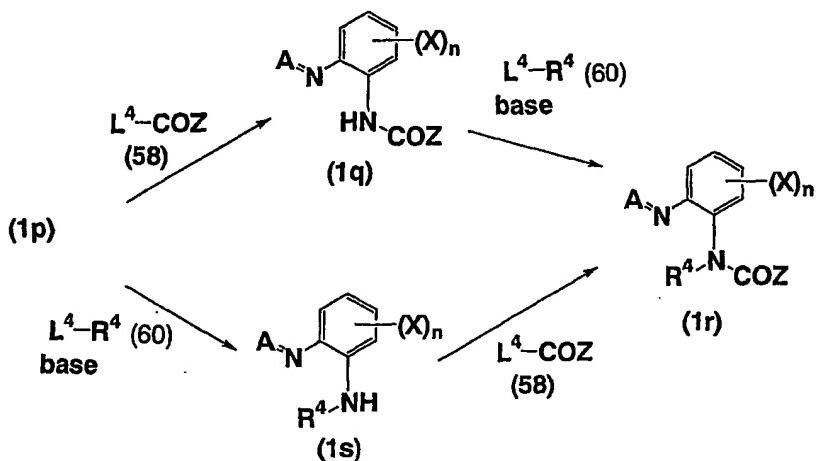
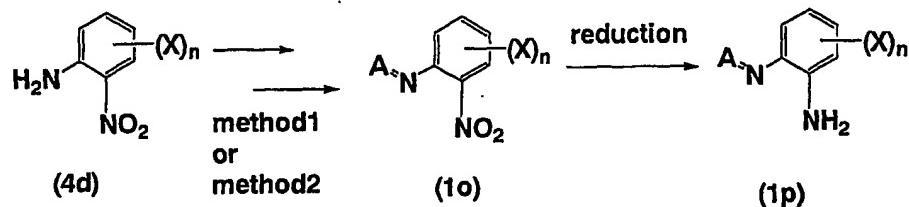
ればよく、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ビリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノビリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。反応温度は、-80°Cから溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0°Cから溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(1 h)に対して、0.05から150当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(59)は(1 h)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

本発明化合物(1 j)から本発明化合物(1 k)を経て本発明化合物(1 l)を得る反応および本発明化合物(1 j)から本発明化合物(1 m)を経て本発明化合物(1 n)を得る反応は、(製造法4)に示した(1 a)から(1 c)および(1 e)をそれぞれ得る方法と同様に実施出来る。

(製造法7)

前記(1)のGが-N(R⁴)C(=O)Z、-N(OR⁴)C(=O)Z、-N(R⁴)CH₂C(=O)Zおよび-N(OR⁴)CH₂C(=O)Z、で表される本発明化合物は、(製造法1)、(製造法2)および(製造法6)に示した方

法のほかに、(製造法1)および(製造法2)における(4)のGの代わりに、ニトロ基を有するアニリン化合物(4d)を出発原料として得られたヘテロイミノベンゼン化合物(1o)から、以下に示すような方法で製造することもできる。



(A, X, n, Z, L⁴, R⁴は前述と同じ意味をあらわす。)

すなわち、ヘテロ環イミノニトロベンゼン化合物(1o)は必要に応じて溶媒中、場合によっては塩基存在下、場合によっては触媒存在下、ニトロ基を還元することにより、ヘテロ環イミノアニリン化合物(1p)とした後、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、カルボニル化合物(58)と反応させることにより、本発明化合物(1q)を得ることが出来る。さらに(1q)は、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、式(60)で表されるアルキルはライドまたはアルキル硫酸エステル等と反応させることによって、本発明化合物(1r)へと変換すること

が出来る。本発明化合物（1 r）はまた、（1 p）をまず（6 0）と反応させた後、カルボニル化合物（5 8）と反応させることによっても得ることが出来る。

（1 o）から（1 p）を得る反応においては、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等のアルコール類、酢酸、蟻酸、プロピオン酸等の有機酸類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピベリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。還元剤としては、例えば、水素化リチウムアルミニウム、水素化ジイソブチルアルミニウム等の水素化アルミニウム類、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素カリウム等の水素化ホウ素類、鉄、亜鉛、銅等の金属類、水素ガス等が挙げられる。触媒としては、塩化銅、塩化パラジウム、パラジウム／活性炭、白金／活性炭等が挙げられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、（1 o）に対して、0.05から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、還元剤の当量としては、還元剤は（1 o）に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

（1 p）から（1 q）を得る反応および（1 s）から（1 r）を得る反応にお

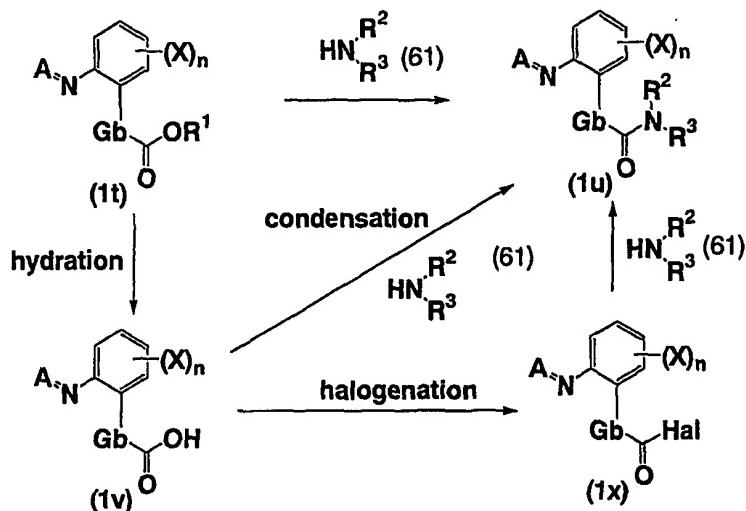
いては、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(1 p) または(1 s) に対して、0.05から150当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(58) は(1 p) または(1 S) に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

また、(1 q) から(1 r) を得る反応および(1 p) から(1 s) を得る反応においては、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピ

ロリドン等のアミド類、ベンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、キシレン、トルエン、ジクロロメタン、クロロホルム、1, 2-ジクロロエタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリプロピルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。反応温度は、-80°Cから溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0°Cから溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。塩基の当量としては、(1q)または(1p)に対して、0.05から150当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、基質の当量としては、(60)は(1q)または(1p)に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

(製造法8)

前記(1)のGが-B-C(=O)-NR₂R₃および-B'-C(=O)-NR₂R₃で表される本発明化合物は、(製造法1)から(製造法6)で示した方法のほかに、(製造法1)から(製造法6)において出発物質として、ZがOR¹で表される化合物を用いて得られた本発明化合物(1-1)から(1-26)、(1-3b)、(1-7b)、(1a)から(1e)、(1i)から(1n)、(1q)および(1r)を用いて、以下に示すような方法によっても得ることが出来る。



(G b は B または B' を表し、 A, X, n, Hal, R¹, R² および R³ は前述と同じ意味を表す。)

すなわち、式 (1 t) で表される化合物を必要に応じて溶媒中、場合によっては塩基存在下、場合によっては触媒存在下、アミン化合物 (6 1) と反応させることにより、(1 u) とすることが出来る。また (1 u) は、必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、必要に応じて酸または塩基存在下、(1 t) を加水分解することによって、(1 v) とした後、必要に応じて溶媒中、場合によっては塩基存在下、場合によっては触媒存在下、アミン化合物 (6 1) と脱水縮合させることによっても得ることが出来る。また、(1 v) を必要に応じて溶媒中、場合によっては触媒存在下、ハロゲン化し、酸ハライド化合物 (1 x) とした後、必要に応じて溶媒中、必要に応じて塩基存在下、場合によっては触媒存在下、アミン化合物 (6 1) と反応させることによっても (1 u) を得ることが出来る。

(1 t) から (1 u) を得る反応においては、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1、2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリ

ル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、メタノール、エタノールまたは水あるいはメタノールおよび水の混合溶媒等が挙げられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から500時間の範囲で行うことができ、1時間から100時間の範囲が好ましい。基質の当量としては、(61)は(1t)に対して、0.5から1000当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

(1t)から(1v)を得る反応においては、溶媒としては反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1、2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、メタノール、エタノール、テトラヒドロフラン、アセトン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミドまたは水あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられる。また、水を溶媒として用いることも出来る。塩基としては、例えば炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。酸としては、塩酸、硫酸等の無機酸や酢酸等の有機酸を用いることが出来る。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から200時間の範囲で行うことができ、1時間から50時間の範囲が好ましい。基質の当量としては、水は(1t)に対して、0.

5から1000当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。塩基および酸の当量としては、(1t)に対して、0.5から1000当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

(1v)から(1u)を得る反応においては、溶媒は反応に不活性であればよく、例えば、メタノール、エタノール等の低級アルコール類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1、2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ジメチルスルホキシドまたは水、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、ジクロロメタン、クロロホルム、1、2-ジクロロエタン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。縮合剤としては、濃硫酸、ジシクロヘキシルカルボジイミド、1,1'-カルボニルジイミダゾール、アゾジカルボン酸ジエチルートリフェニルホスフィン、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド等が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムプロミド、ジメチルアミノピリジン等が用いられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から200時間の範囲で行うことができ、1時間から50時間の範囲が好ましい。基質の当量としては、(61)は(1v)に対して、0.5から1000当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

(1v)から(1x)を得る反応においては、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1、2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメ

チルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、トルエン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、アセトン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。触媒としては、例えば、N,N-ジメチルホルムアミドやテトラ-N-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。ハロゲン化剤としては、オキシ塩化リン、塩化スルフリル、塩化チオニル、シュウ酸ジクロライド、塩素ガス、五塩化リン、三塩化リン、臭素、N-ブロモコハク酸イミド、N-クロロコハク酸イミド、テトラブチルアンモニウムトリプロマイド、三臭化リン、オキシ臭化リン等が挙げられる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から10時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。基質の当量としては、ハロゲン化剤は(1v)に対して、0.5から5.0当量の範囲で用いることができ、1から2.0当量の範囲が好ましい。また、(1x)から(1u)を得る反応において、溶媒としては、反応に不活性であればよく、例えば、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、ベンゼン、キシレン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、プロピオニトリル等のニトリル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、N-メチルピロリドン等のアミド類、ペンタン、ヘキサン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、あるいはこれらの混合溶媒等が挙げられ、好ましくは、テトラヒドロフラン、ベンゼン、トルエン、クロロホルム、1,2-ジクロロエタン、アセトン、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等が挙げられる。塩基としては、例えば、トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジン、4-ジメチルアミノピリジン等の有機塩基や炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が用いられる。触媒としては、例えば、テトラ-N-ブチルアンモニウムプロミド等が用いられる。また、塩基および触媒を用いずに、溶媒中

で加熱することによっても（1 u）を得ることができる。反応温度は、-80℃から溶媒の沸点の範囲で行うことができ、0℃から溶媒の沸点の範囲が好ましい。反応時間としては、5分から100時間の範囲で行うことができ、1時間から48時間の範囲が好ましい。基質の当量としては、（61）は（1x）に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。また、塩基の等量としては、（1x）に対して、0.5から50当量の範囲で用いることができ、1から20当量の範囲が好ましい。

（製造法1）における出発物質である式（3）で表されるニトロ化合物は、公知の方法で製造できる。

例えば、Gが-CH₂C(=O)Zで表されるニトロフェニル酢酸化合物は、ヨーロッパ特許出願公報（EP-570817号公報）、シンセシス（Synthesis）51頁（1993年）、ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー（J. Org. Chem.）第61巻、5994頁（1996年）等に記載の公知の方法で製造できる。

また、Gが-N(R⁴)C(=O)Z、-N(OR⁴)C(=O)Z、-N(R⁴)CH₂C(=O)Zおよび-N(OR⁴)CH₂C(=O)Zで表されるニトロアニリン化合物は、オーガニック・ファンクショナル・グループ・プリパレーションズ（Organic Functional Group Preparations）（Academic Press）第2巻、第10章～第12章（1971年）等に記載の公知の方法でオルトニトロアニリンまたはオルトハロニトロベンゼン等から製造できる。

また、Gが-O-C(=O)Z、-O-CH₂C(=O)Z、-S-C(=O)Zおよび-S-CH₂C(=O)Zで表されるニトロフェノールおよびニトロチオフェノール化合物は、文献記載の公知の方法でオルトフェノールまたはオルトチオフェノールから製造できる。

また、Gが-CH₂-A²aで表される化合物は、ニトロフェニル酢酸を原料に、国際出願公開WO94/22844号公報および国際出願公開WO95/04728号公報に記載されている方法により製造することができる。

また、B²が-C(=NOR⁴)-でA²がA²aのものは、国際出願公開WO9

5 / 0 4 7 2 8 号公報に記載の方法によって製造することができる。

また、 A^2 が A^2a 、 A^2d 、 A^2f 、 A^2g 、 A^2h のとき、 B^2 が $-CH_2-$ 、 $-C(=CHOR^4)-$ または $-C(=NOR^4)-$ である化合物については、ニトロフェニル酢酸を原料に、国際出願公開WO 94/22844号公報に記載されている方法により製造することができ、 B^2 が $-CH(CN)-$ 、 $-CH(C\equiv CH)-$ 、 $-CH(OR^4)-$ 、 $-N(OR^4)-$ 、 $-N(R^4)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-N(OR^4)CH_2-$ 、 $-N(R^4)CH_2-$ 、 $-OCH_2-$ 、 $-SCH_2-$ である化合物については、ニトロフェニル酢酸エステルのメチレン部分をそれぞれ B^2 に置き換えた化合物を出発原料にして同様に製造することができる。 A^2 が A^2b 、 A^2c 、 A^2d 、 A^2g 、 A^2i 、 A^2m 、 A^2n 、 A^2o 、 A^2p または A^2q のとき、 B^2 が $-C(=NOR^4)-$ である化合物は、国際出願公開WO 95/26956号公報記載の方法で製造することができ、 B^2 が $-CH(CN)-$ 、 $-CH(C\equiv CH)-$ 、 $-CH(OR^4)-$ 、 $-N(OR^4)CH_2-$ 、 $-N(R^4)CH_2-$ 、 $-OCH_2-$ または $-SCH_2-$ である化合物は、原料であるハライドあるいはシアノ化合物を適宜変えることで同様に製造することができる。 A^2 が置換されていてもよいピリジル、 A^2e 、 A^2j または A^2k で B^2 が $-CH(OR^4)-$ である化合物は、国際出願公開WO 97/12863号公報に記載された方法により製造することができる。 A^2 が A^2a 、 A^2d 、 A^2e 、 A^2f 、 A^2g 、 A^2h 、 A^2i 、 A^2j 、 A^2k または1で B^2 が $-N(OR^4)-$ 、 $-N(R^4)-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ の化合物については、例えば $-B^2-H$ が置換したニトロベンゼン化合物と A^2-L （但し、Lは良好な脱離基例えば、ハロゲン原子、メタンスルホニル基等を表す。）との反応か、またはL（但し、Lは前記と同様の意味を表す。）が置換したニトロベンゼン化合物と A^2-B^2-H との反応により製造することができる。 A^2 が A^2l の化合物は国際出願公開WO 96/17835号公報記載の方法で、 A^2 が A^2q の化合物は国際出願公開WO 99/7687号公報記載の方法で、それぞれ製造することができる。

また、ニトロベンゼンのオルト位に G^2 、 G^5 、 G^6 または G^7 で表される基が置換した化合物は、例えば国際出願公開WO 95/14009、国際出願公開WO 96/26191、国際出願公開WO 96/36615あるいは特開平9-10

4 6 7 6 号公報記載の方法を参考に、G³またはG⁹で表される基が置換した化合物は、例えばWO 99/20615記載の方法を参考に、G⁴が置換した化合物は、例えば国際出願公開WO 96/36229記載の方法を参考に、G¹⁰が置換した化合物は、例えばドイツ特許19756115記載の方法を参考に、G¹¹、G¹²またはG¹⁴が置換した化合物は、例えば特開平11-335361号公報記載の方法を参考に、G¹³が置換した化合物は、例えば特開平11-220050号公報、特開平7-179450号公報等記載の方法を参考に、それぞれ製造することができる。

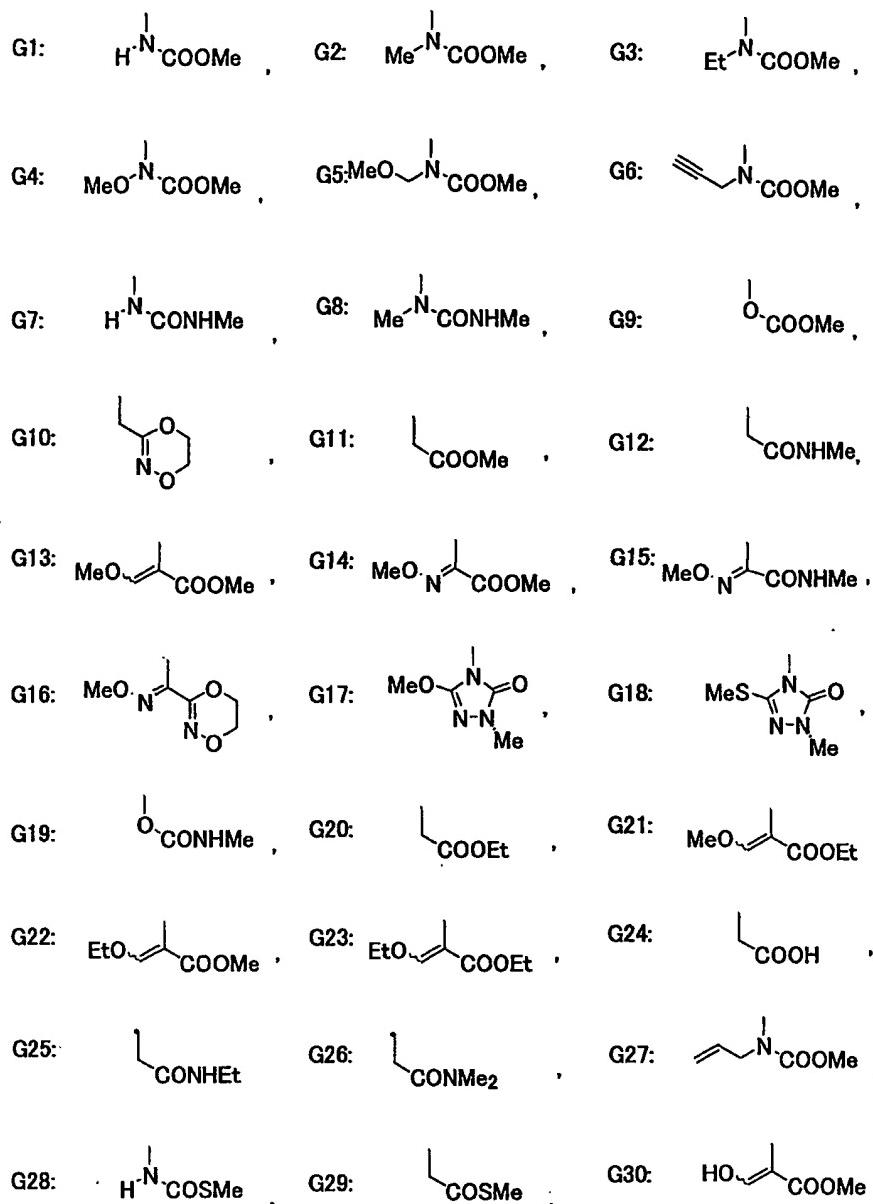
それぞれの工程で製造される本発明化合物またはその中間体は常法により反応液から得ることができるが、化合物を精製する必要が生じた場合には、再結晶、カラムクロマトグラフィー等の任意の精製法によって分離、精製することができる。

次に、本発明に包含される化合物の例を第1表から第7表に示す。但し、本発明化合物は、これらのみに限定されるものではない。

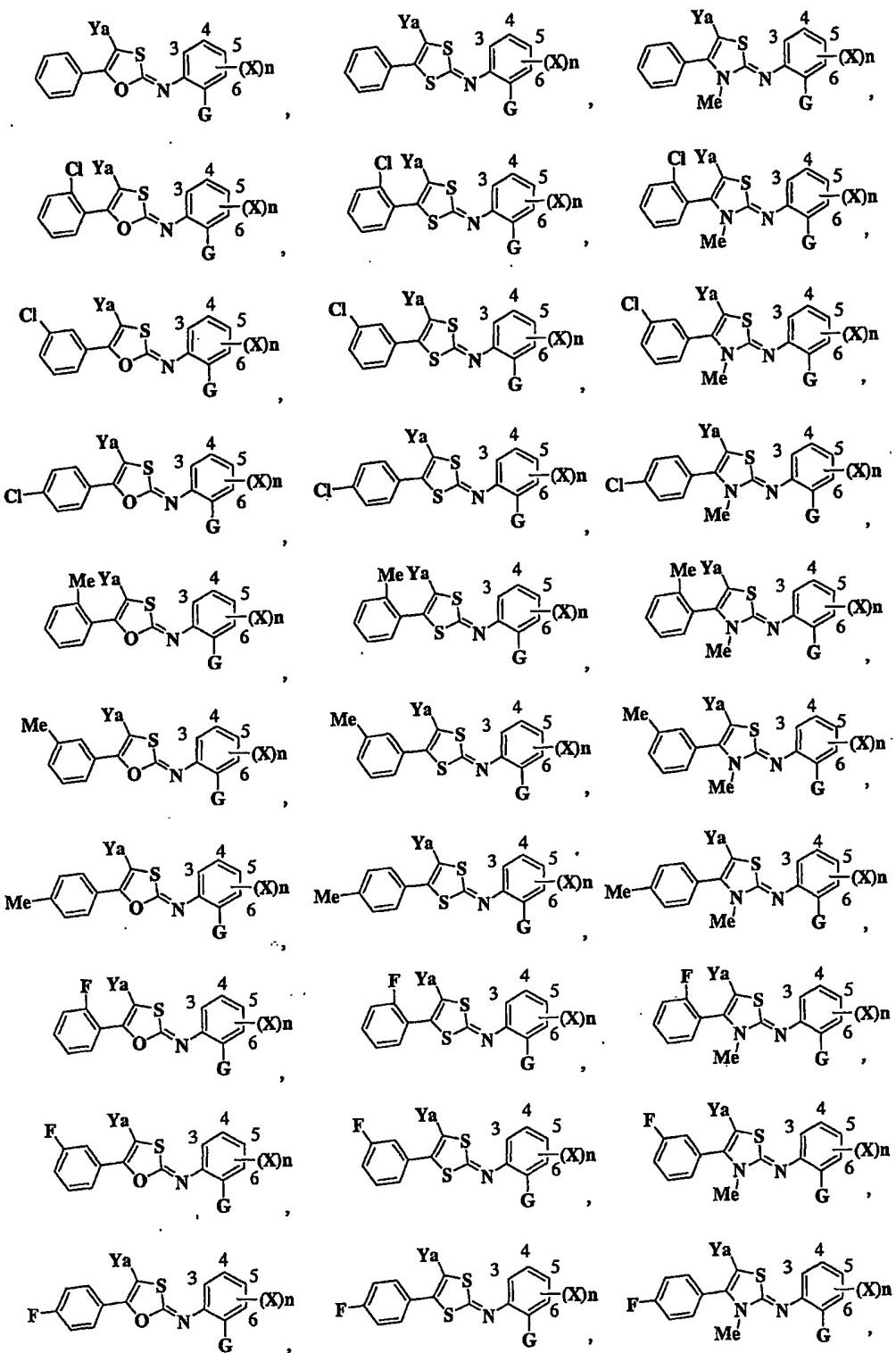
なお、表中の略号はそれぞれ以下の意味を示す。

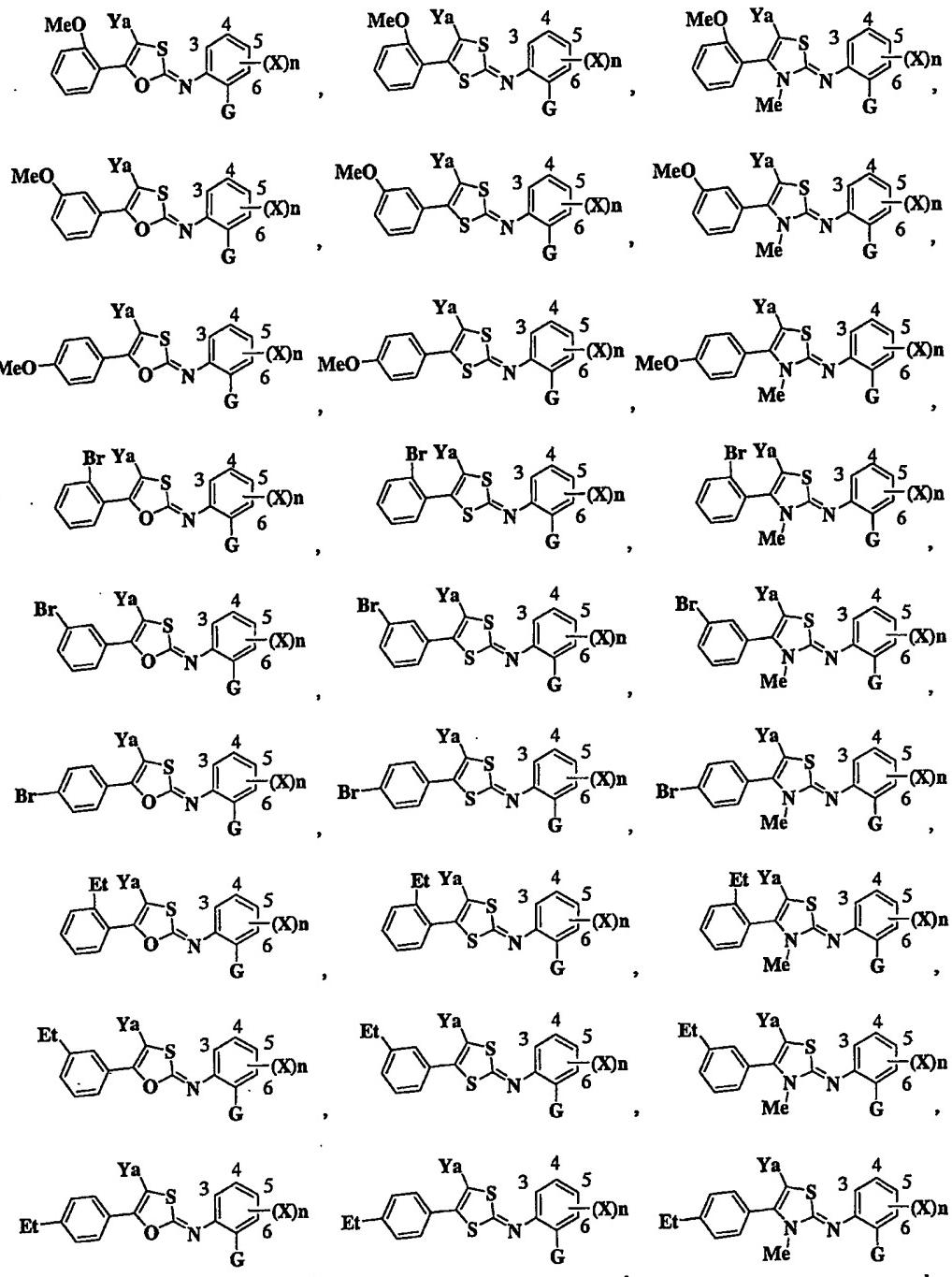
M e : メチル基、E t : エチル基、P r : プロピル基、B u : ブチル基、P e n : ペンチル基、H e x : ヘキシル基、P h : フェニル基、n : ノーマル、i : イソ、s : セカンダリー、t : ターシャリー、c : シクロ。

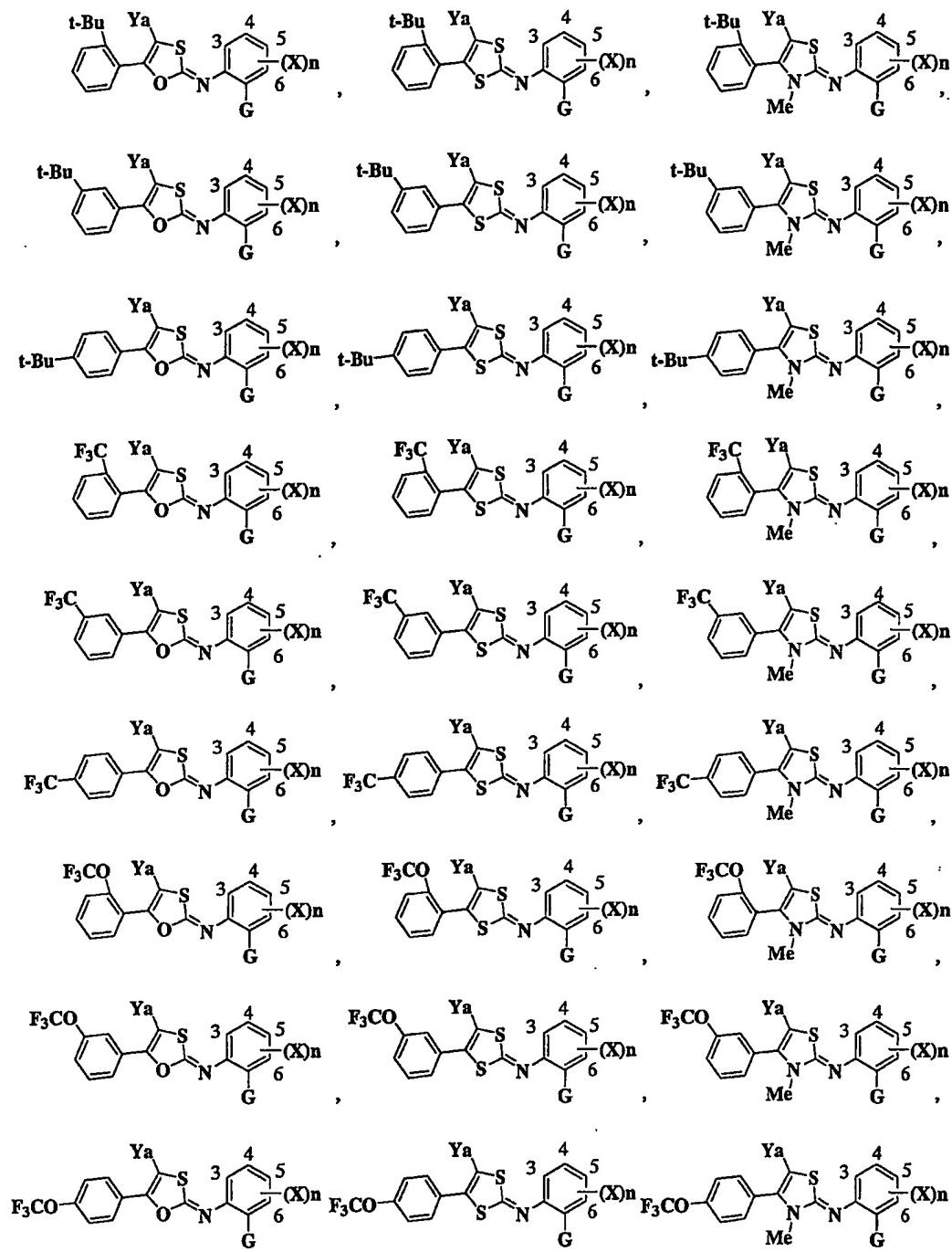
G1からG30は以下のものを表す。

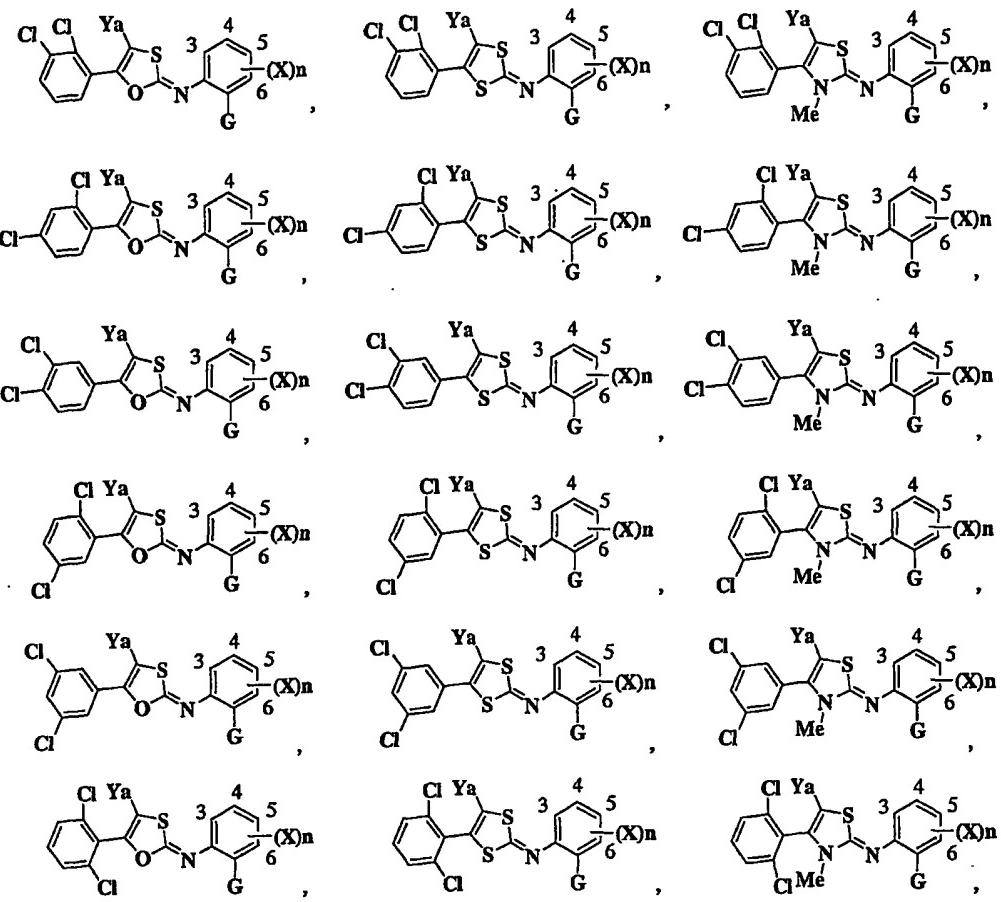


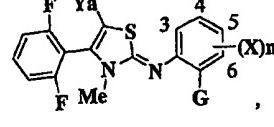
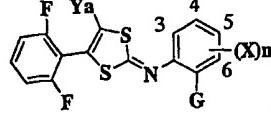
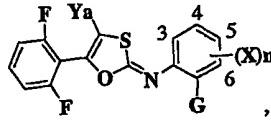
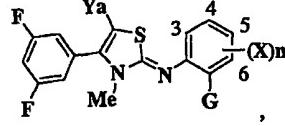
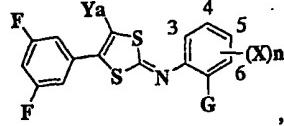
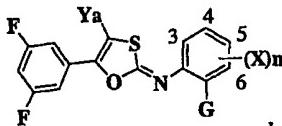
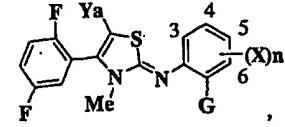
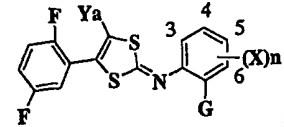
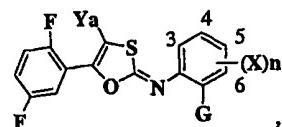
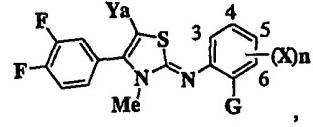
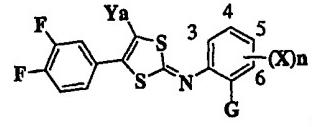
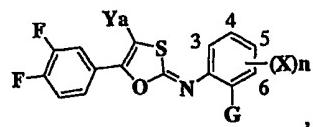
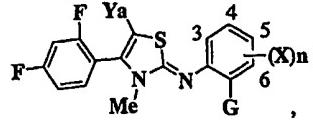
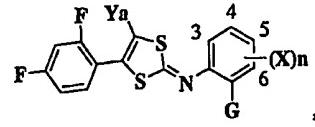
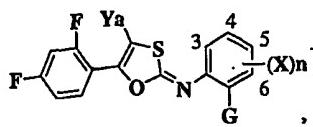
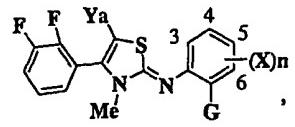
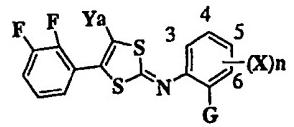
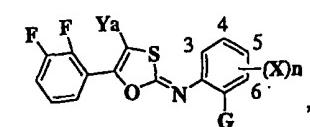
〔第1表〕

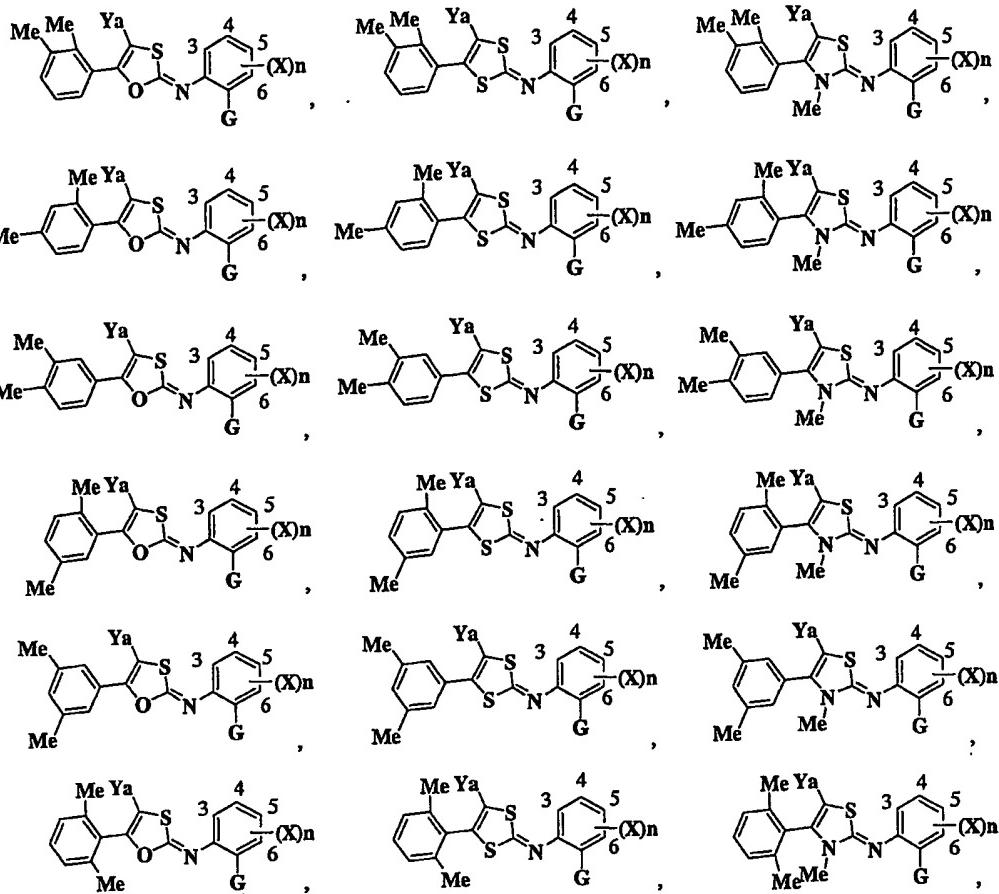


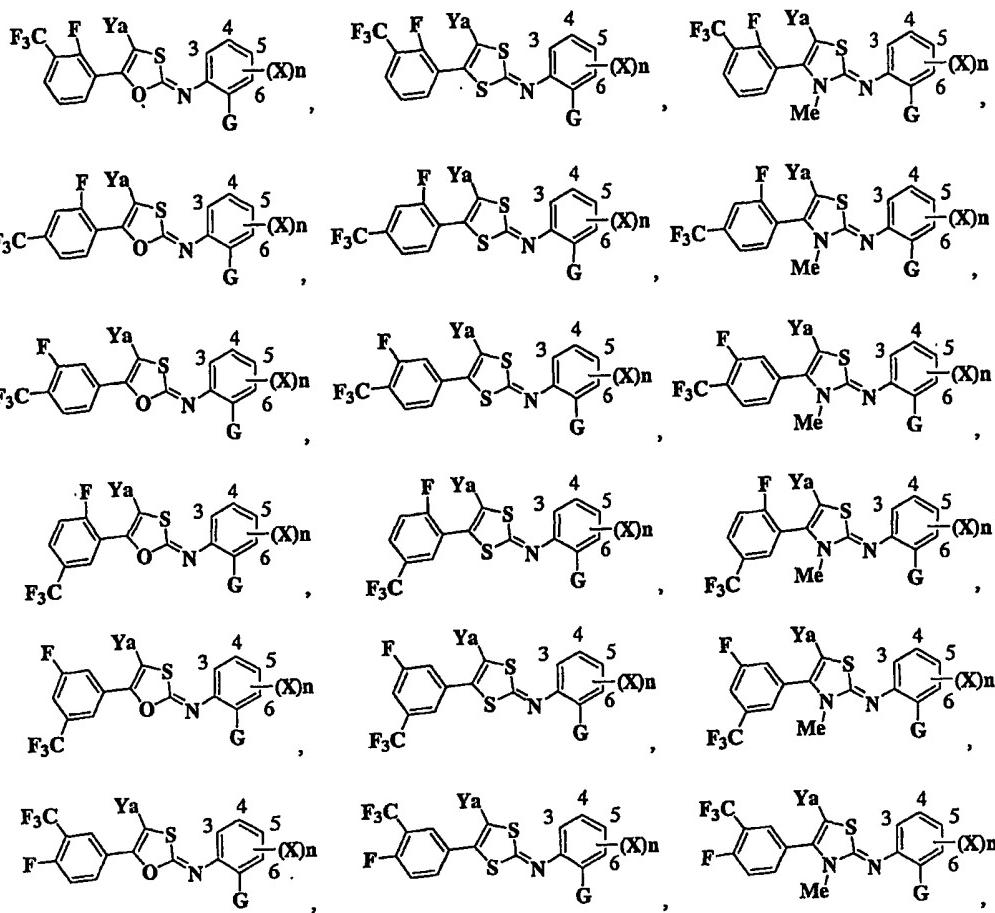


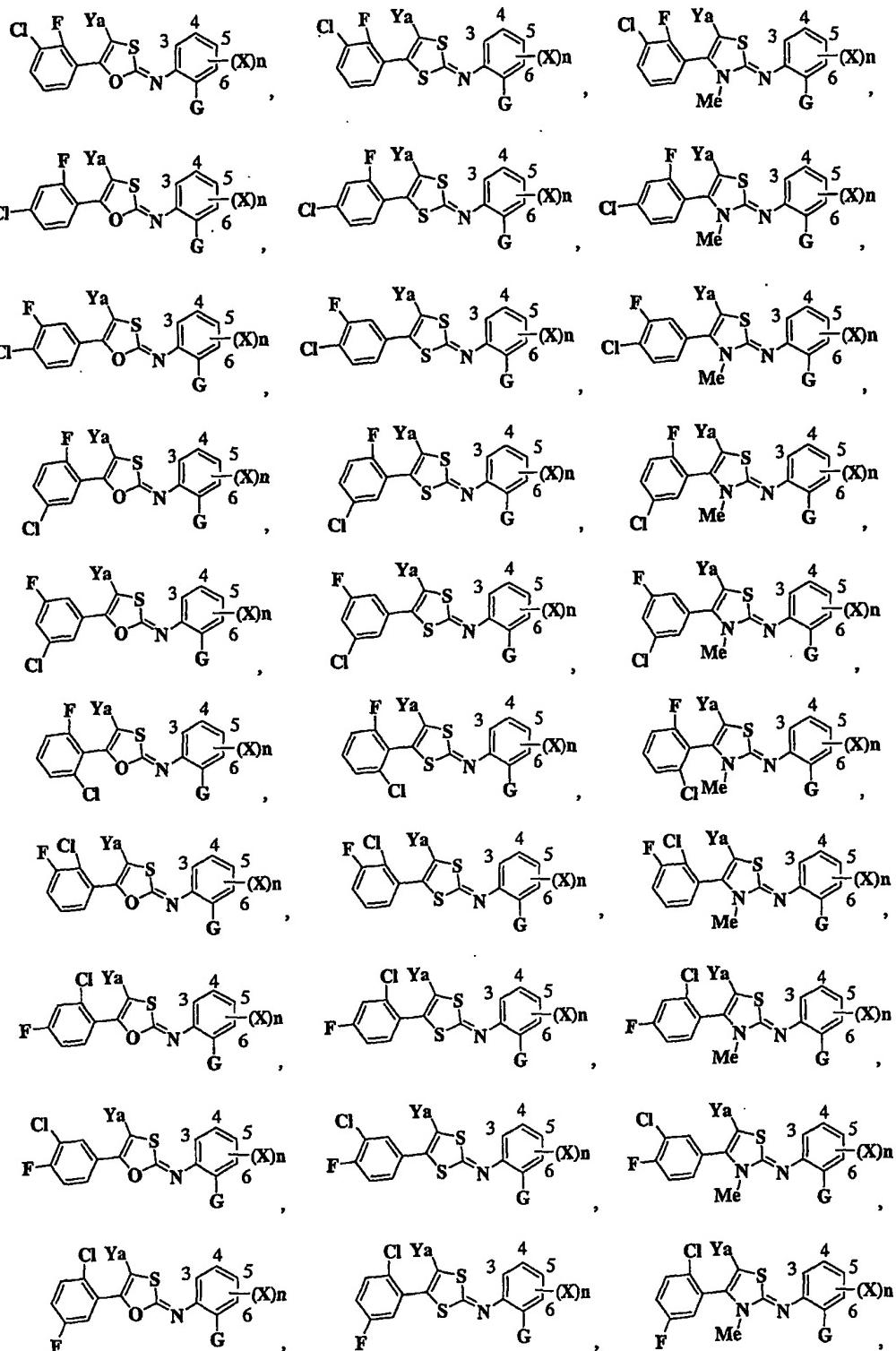


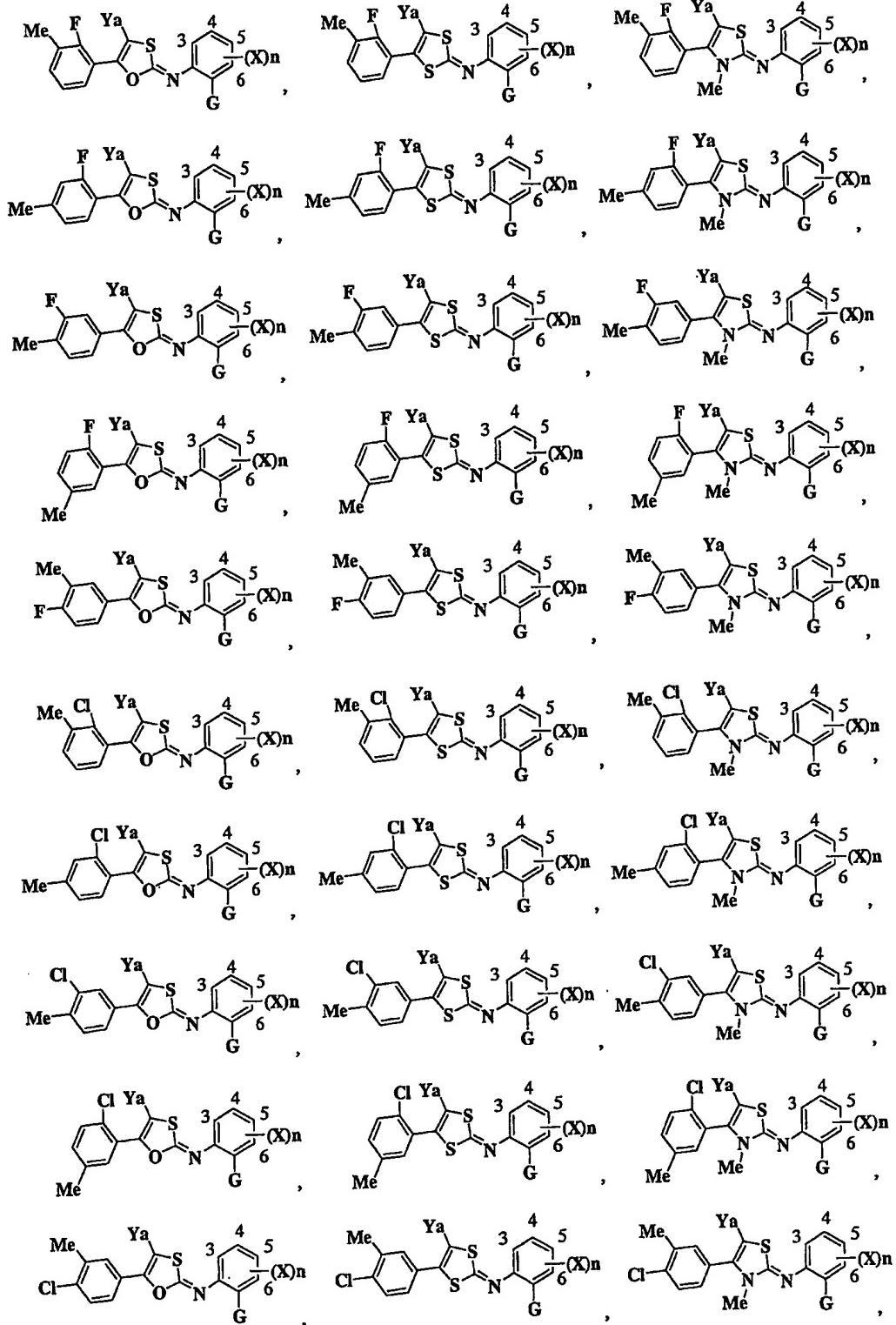


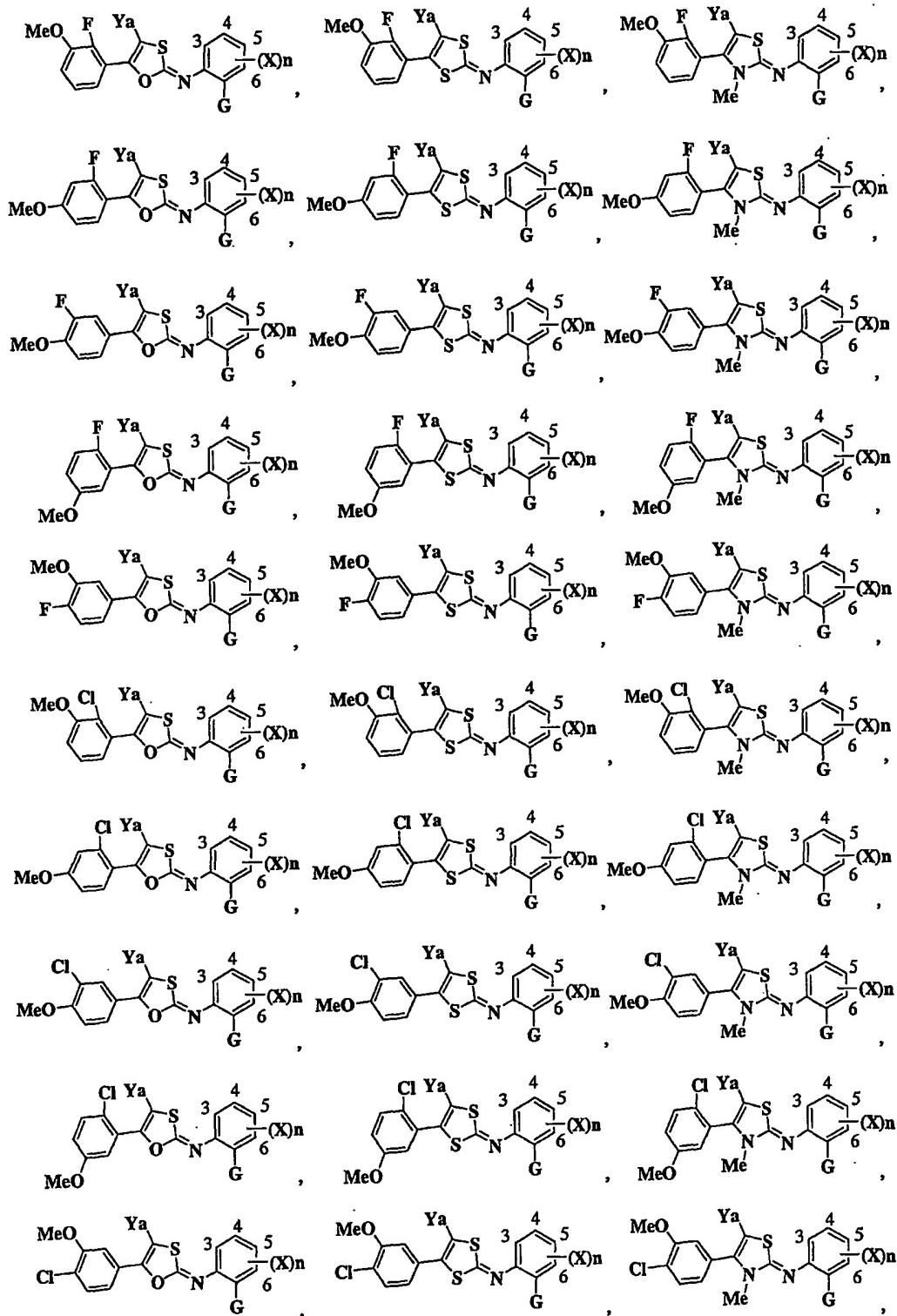


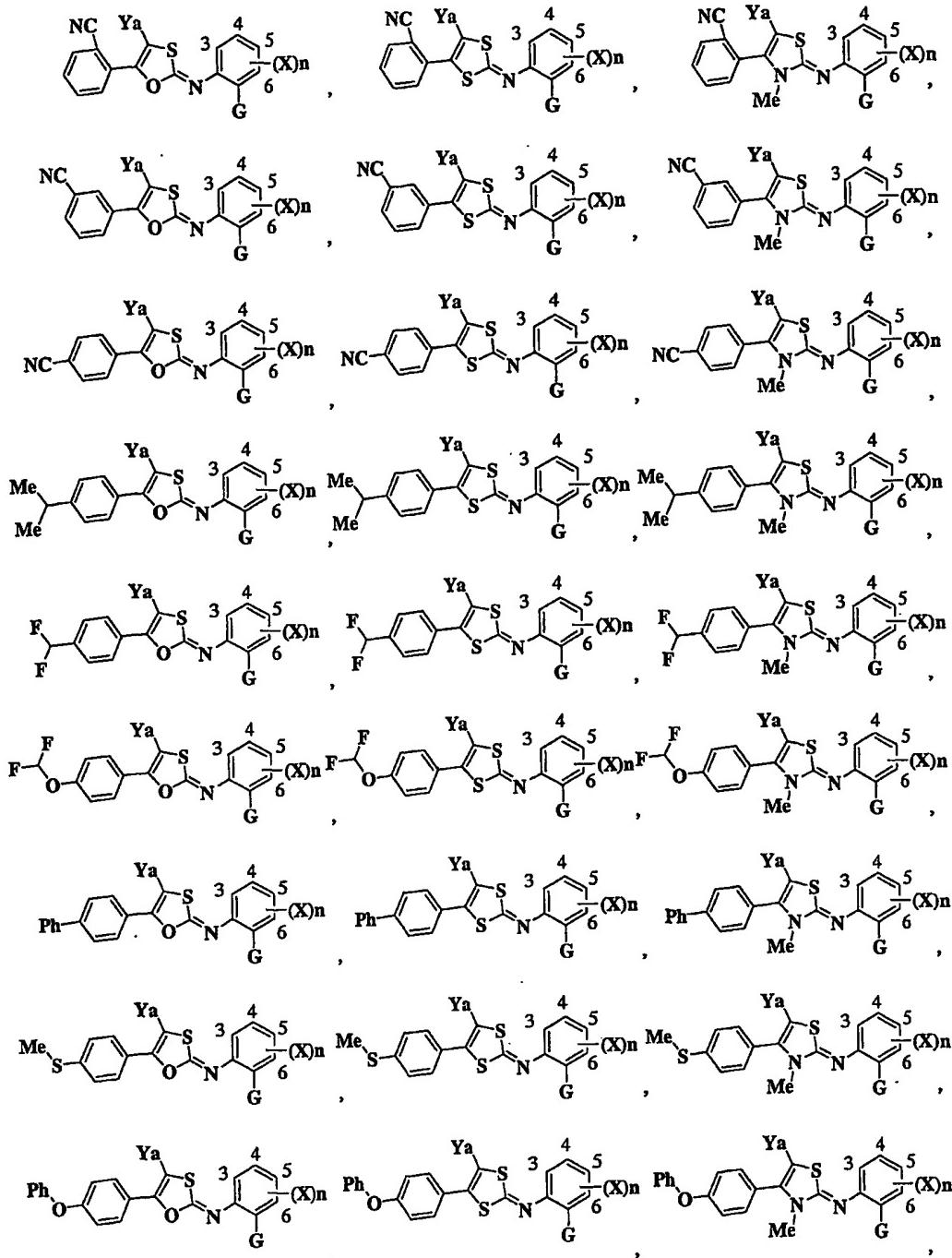


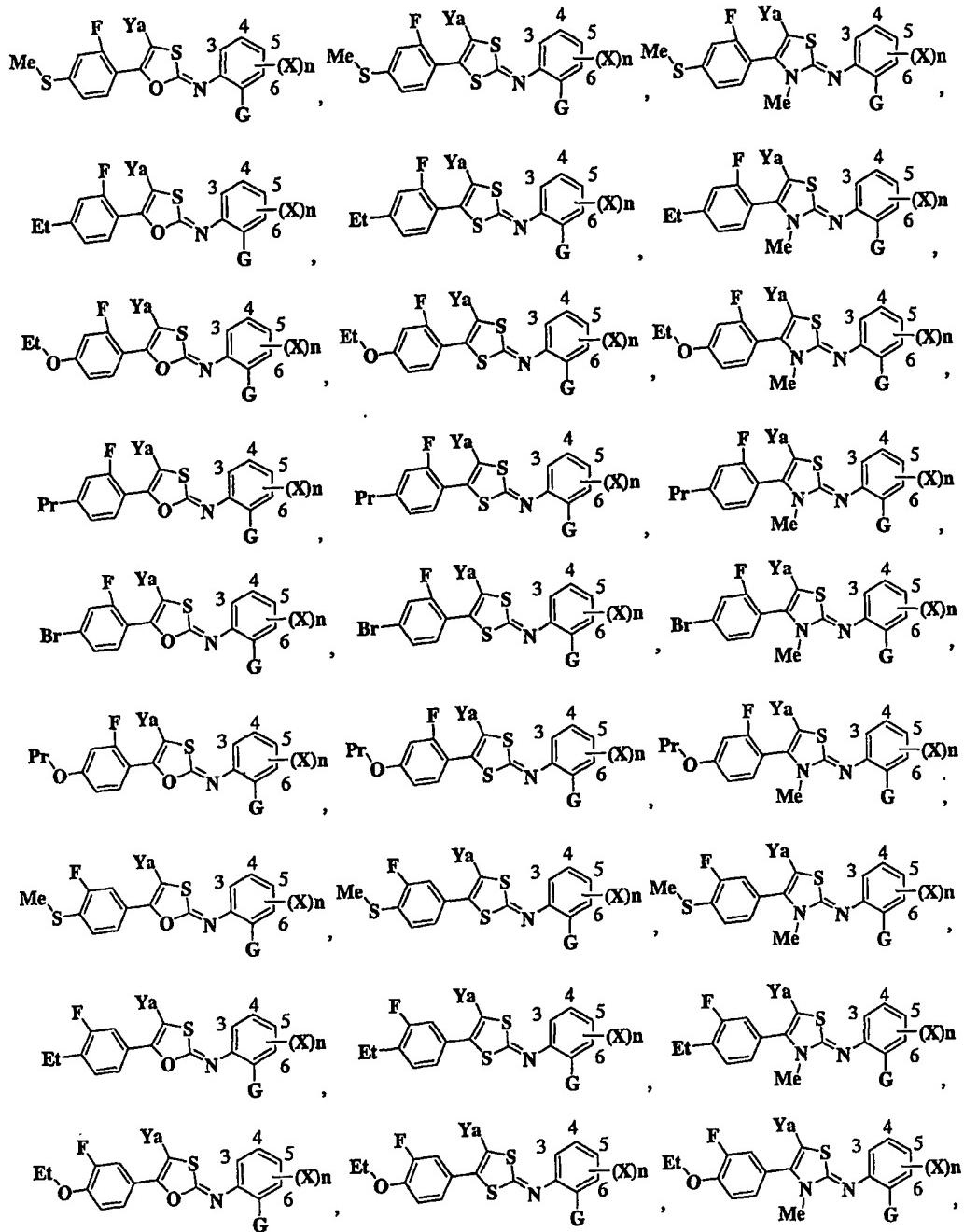


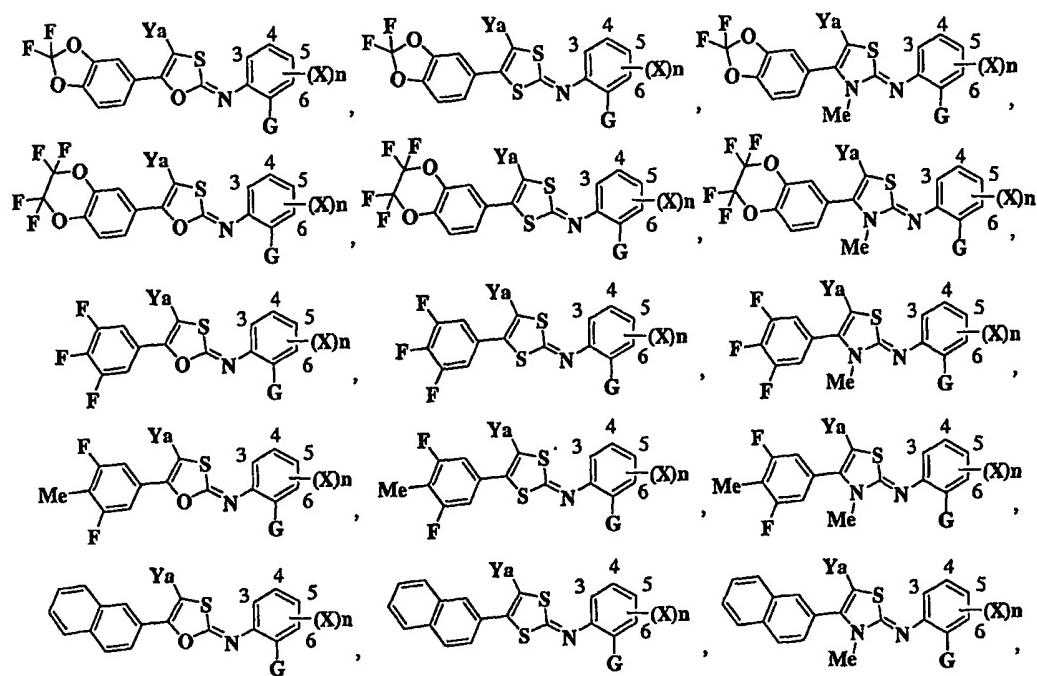


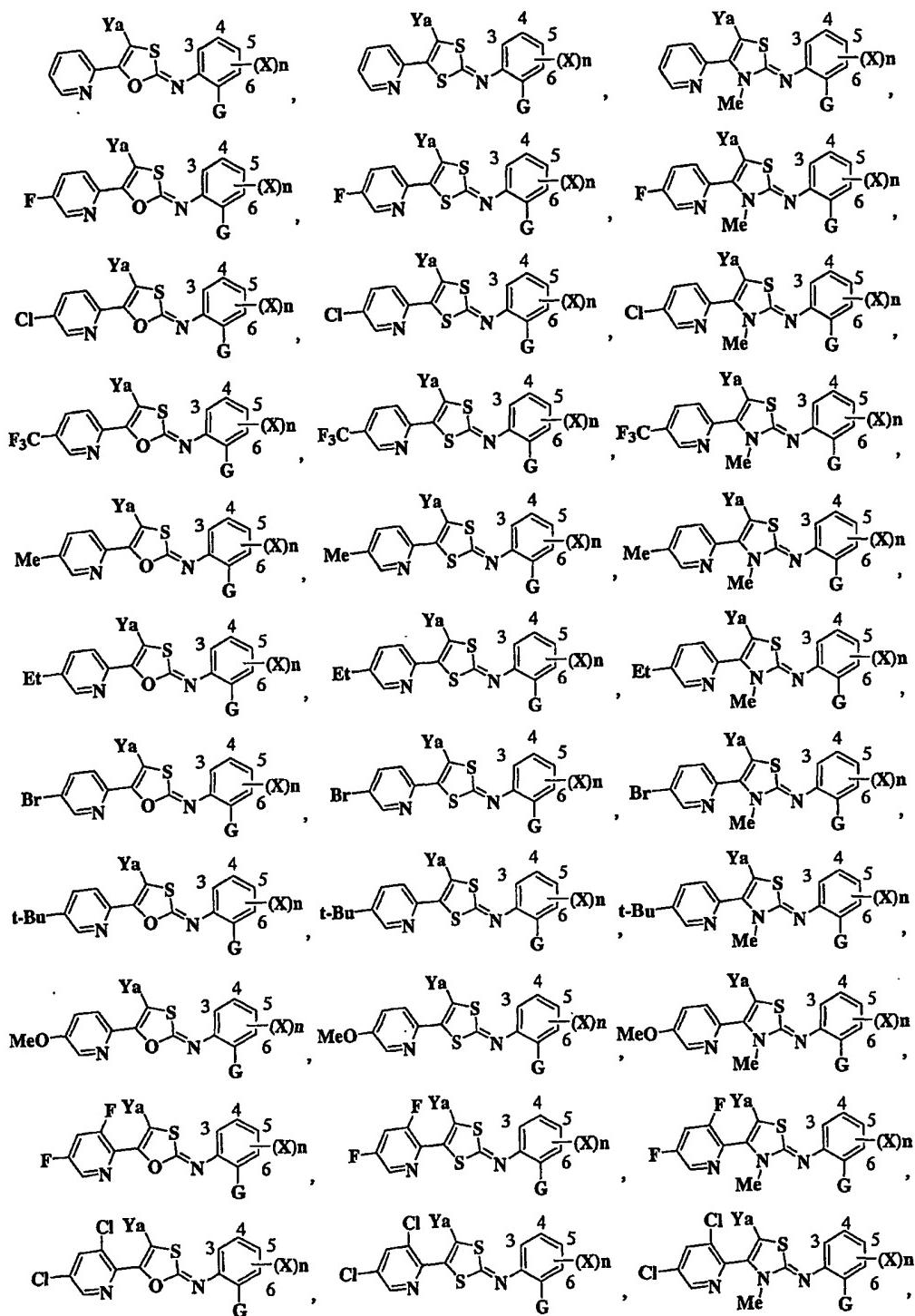


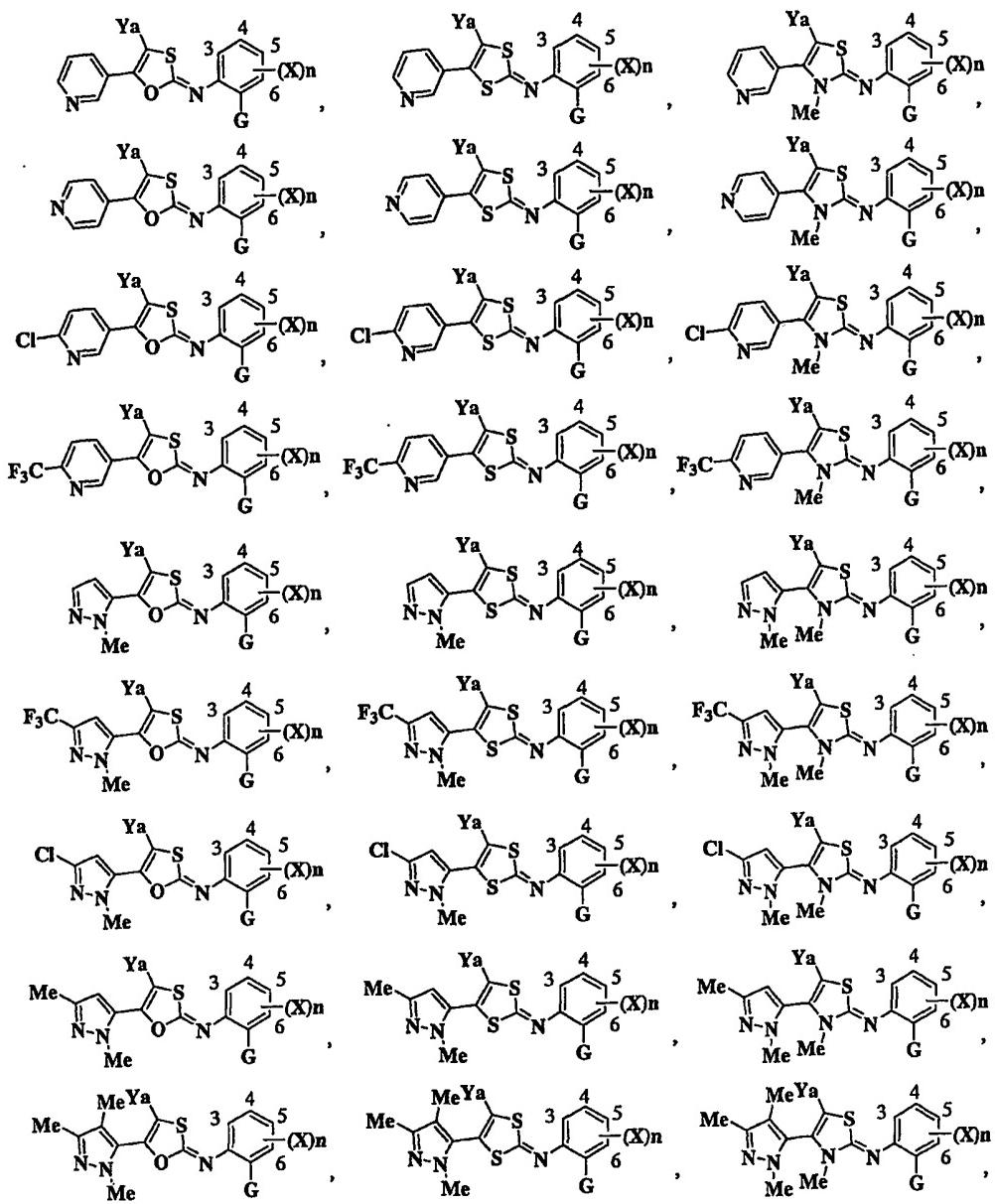


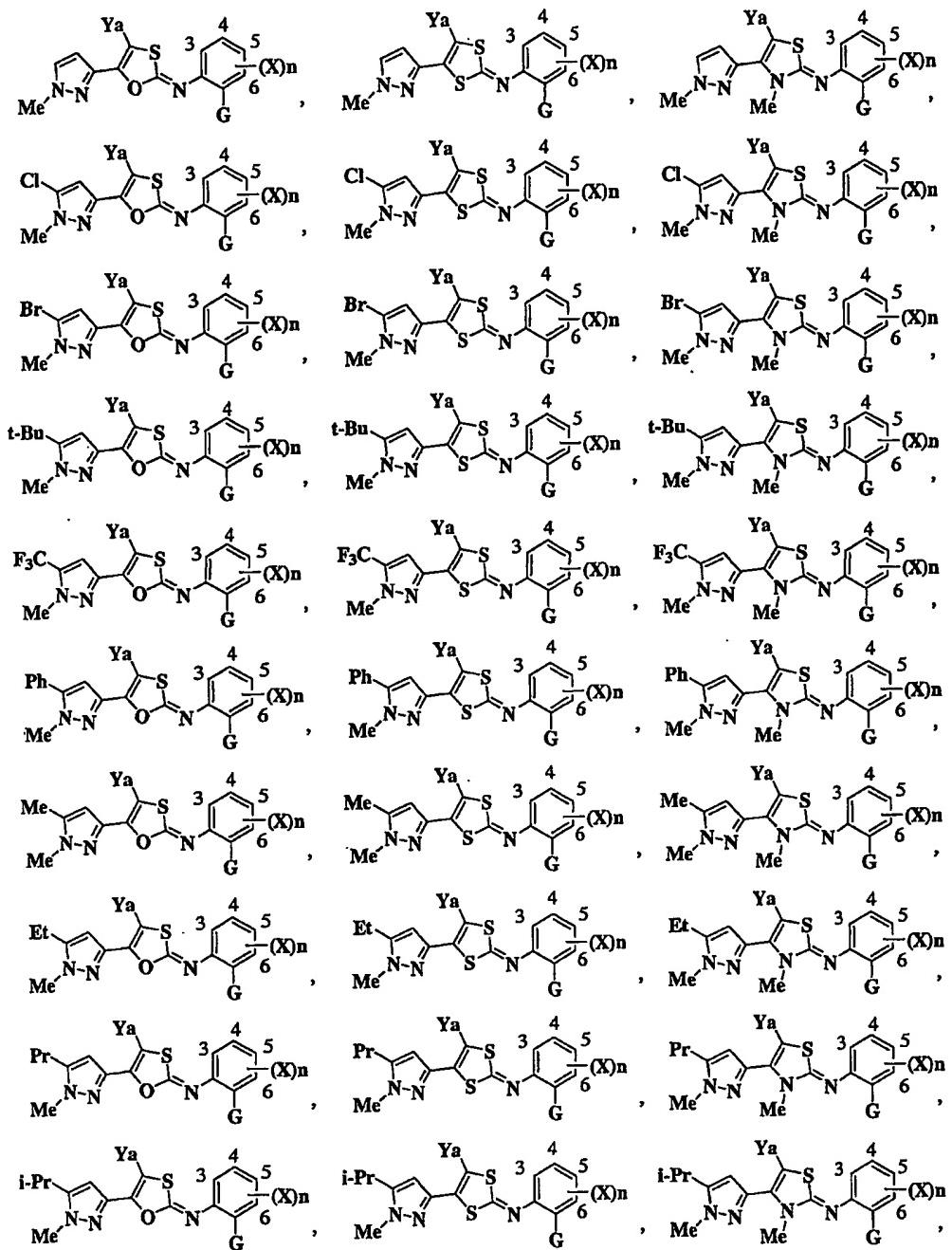


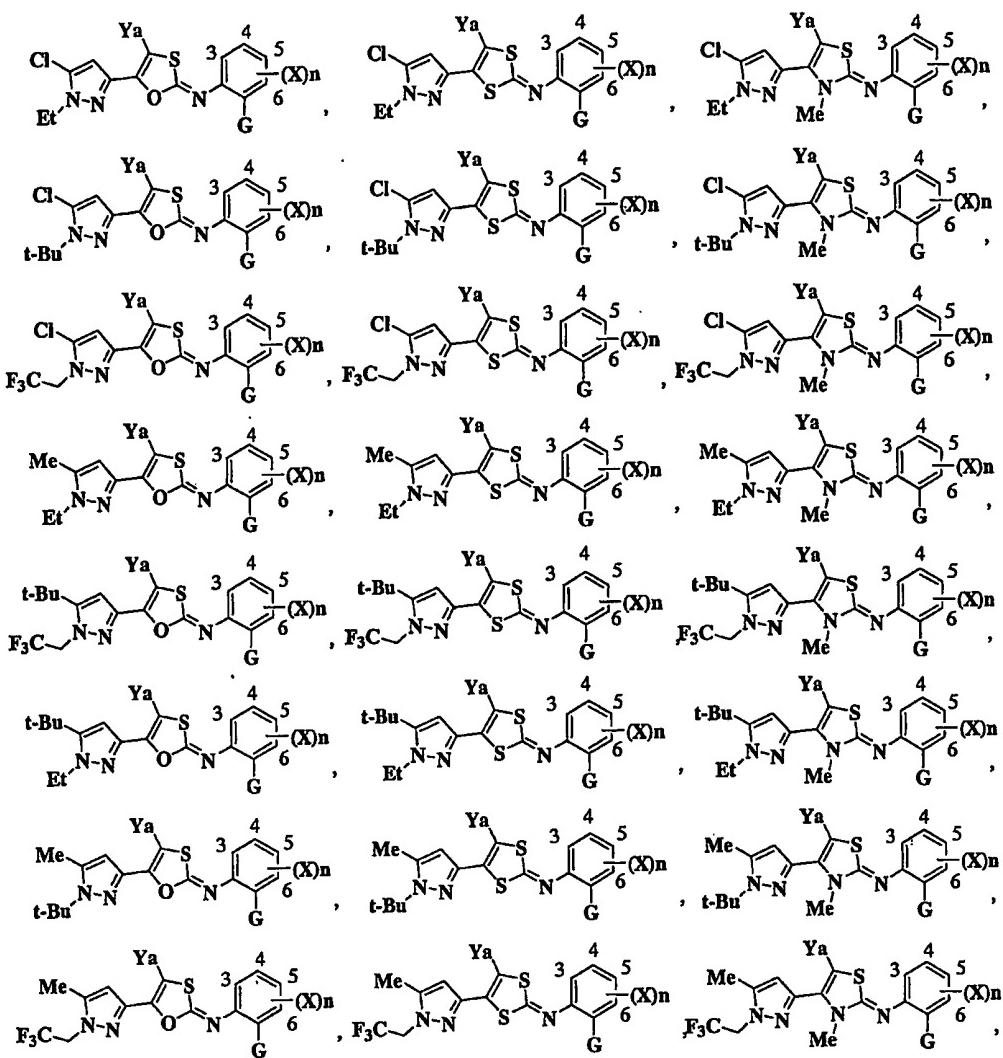


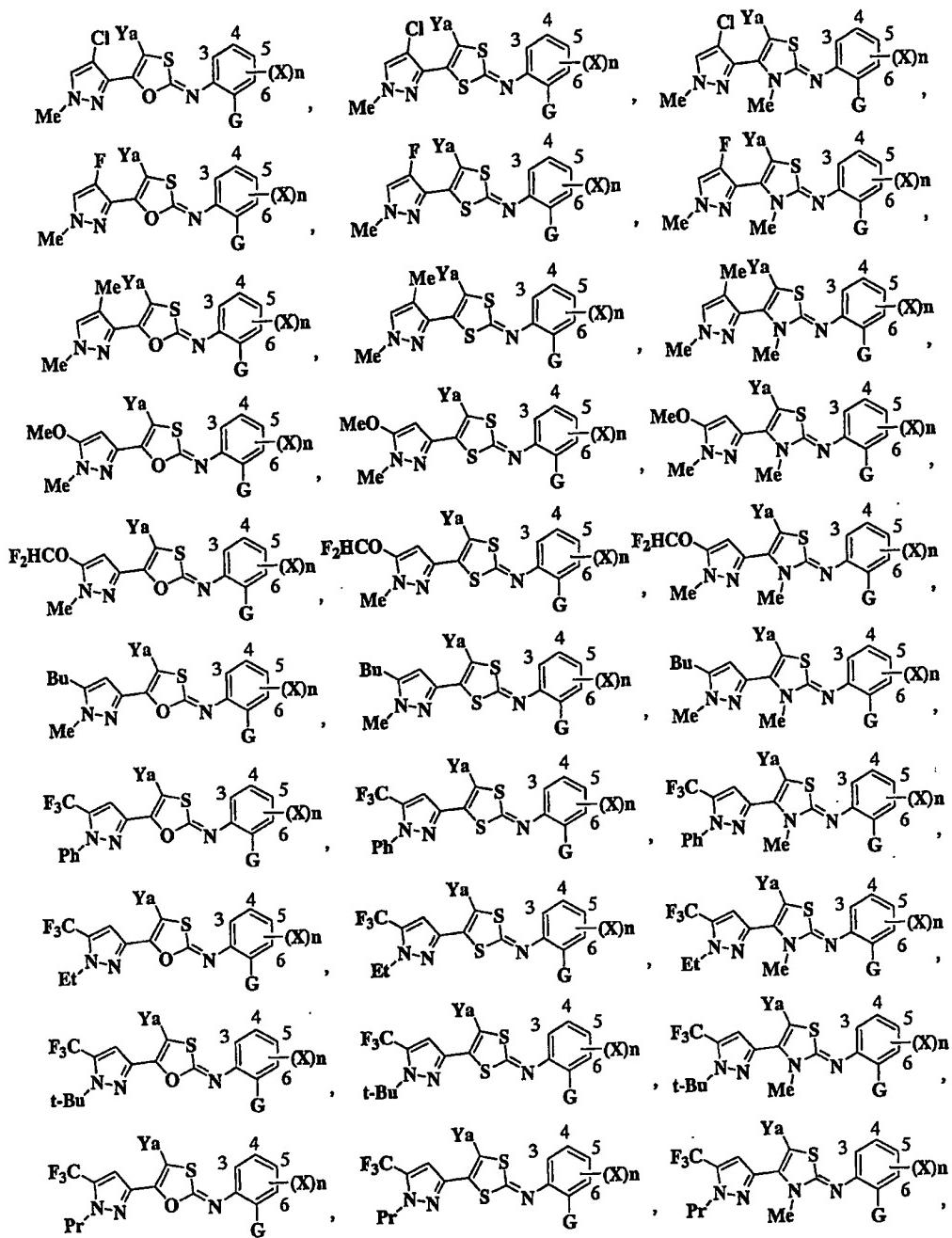


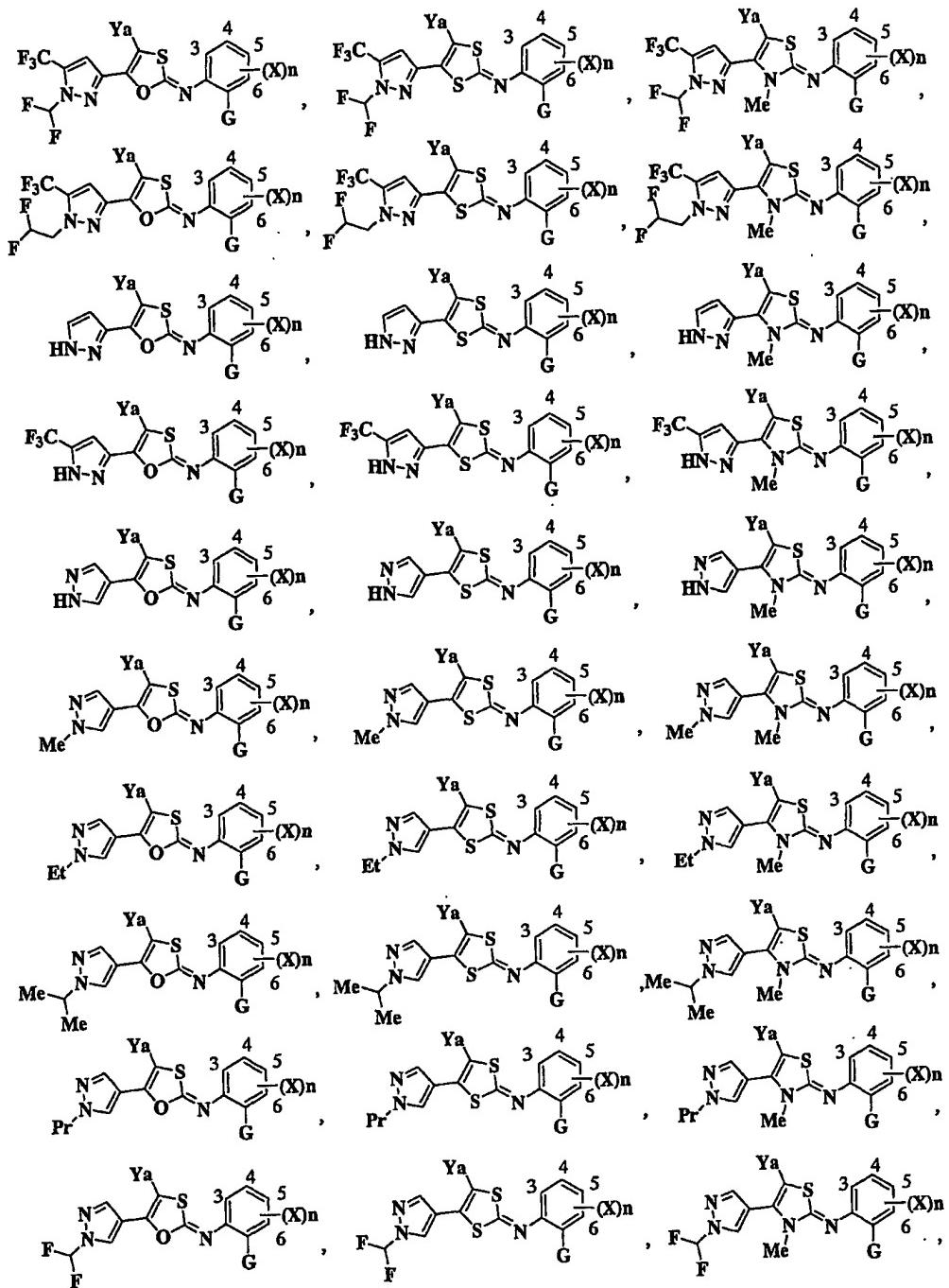


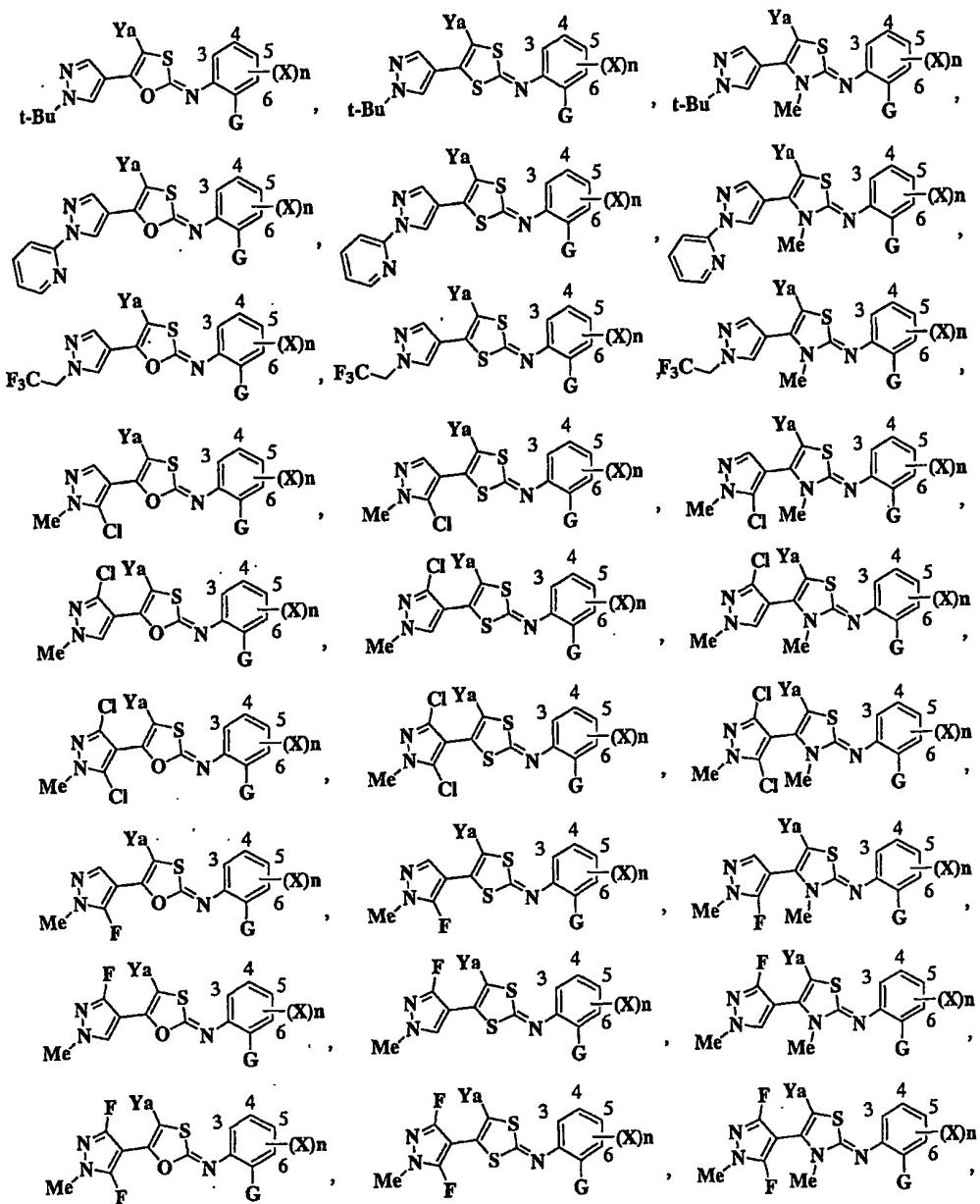


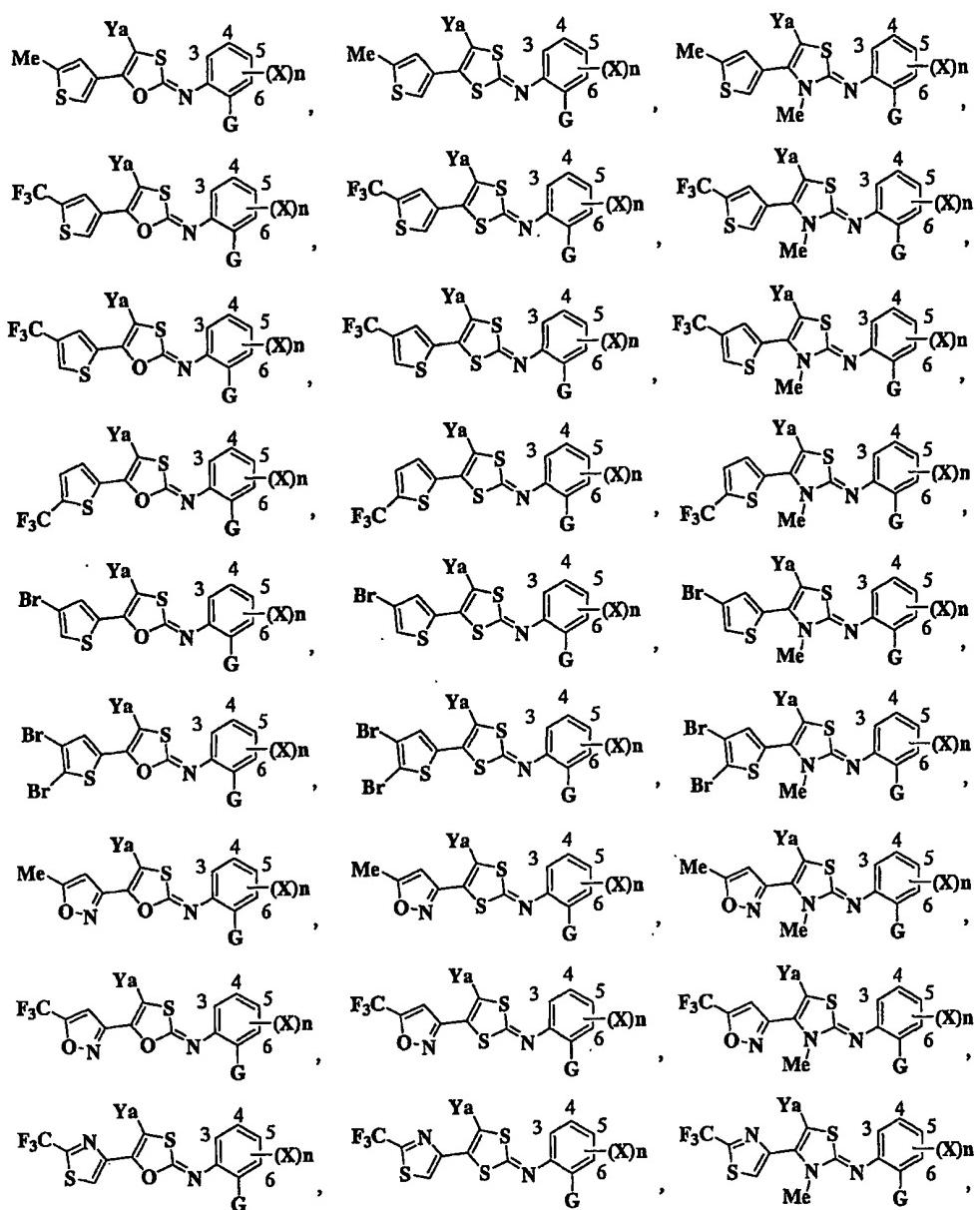


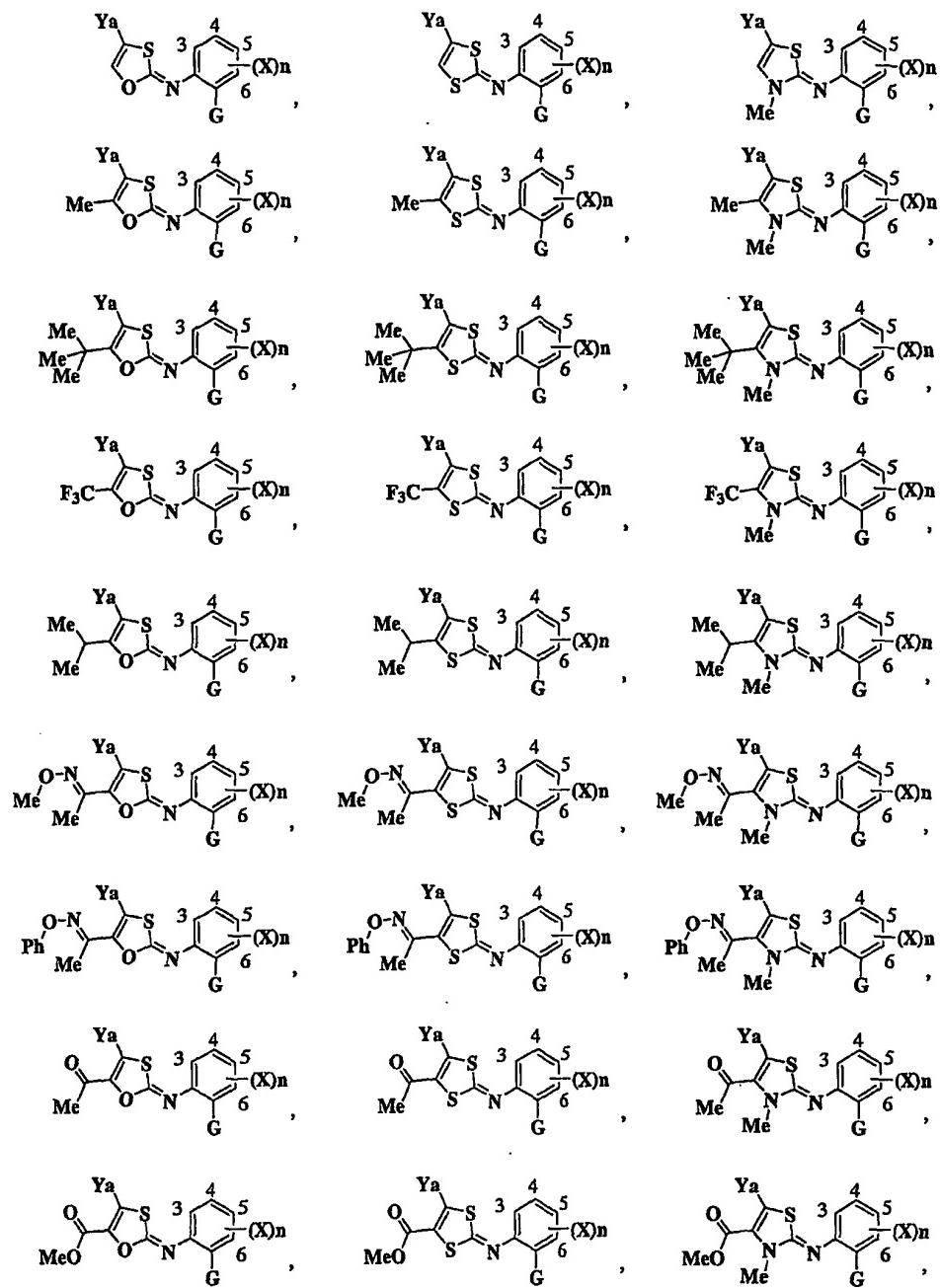












Y a	X n	G
H	H	G1
H	3-Me	G1
H	4-Me	G1
H	5-Me	G1

H	6-Me	G1
H	4-Et	G1
H	4-t-Bu	G1
H	4-i-Pr	G1
H	4-CF ₃	G1
H	4-OMe	G1
H	6-OMe	G1
H	4-OEt	G1
H	4-SMe	G1
H	4-NMe ₂	G1
H	3-F	G1
H	4-F	G1
H	5-F	G1
H	6-F	G1
H	4-Cl	G1
H	6-Cl	G1
H	4-Br	G1
H	4-I	G1
H	4-CN	G1
H	4, 5-Me ₂	G1
H	4, 6-Me ₂	G1
H	4, 5-(OMe) ₂	G1
Me	H	G1
Me	3-Me	G1
Me	4-Me	G1
Me	5-Me	G1
Me	6-Me	G1
Me	3-Et	G1
Me	4-Et	G1
Me	5-Et	G1
Me	6-Et	G1
Me	4-t-Bu	G1
Me	4-i-Pr	G1
Me	3-CF ₃	G1
Me	4-CF ₃	G1
Me	5-CF ₃	G1
Me	6-CF ₃	G1
Me	3-OMe	G1
Me	4-OMe	G1
Me	5-OMe	G1
Me	6-OMe	G1
Me	3-OEt	G1
Me	4-OEt	G1
Me	5-OEt	G1
Me	6-OEt	G1
Me	3-SMe	G1
Me	4-SMe	G1
Me	5-SMe	G1
Me	6-SMe	G1
Me	3-NMe ₂	G1
Me	4-NMe ₂	G1
Me	5-NMe ₂	G1
Me	6-NMe ₂	G1
Me	3-F	G1
Me	4-F	G1
Me	5-F	G1
Me	6-F	G1
Me	3-Cl	G1

Me	4-Cl	G1
Me	5-Cl	G1
Me	6-Cl	G1
Me	3-Br	G1
Me	4-Br	G1
Me	5-Br	G1
Me	6-Br	G1
Me	3-I	G1
Me	4-I	G1
Me	5-I	G1
Me	6-I	G1
Me	3-CN	G1
Me	4-CN	G1
Me	5-CN	G1
Me	6-CN	G1
Me	4, 5-Me ₂	G1
Me	4, 6-Me ₂	G1
Me	5, 6-Me ₂	G1
Me	4, 5-Cl ₂	G1
Me	4, 6-Cl ₂	G1
Me	5, 6-Cl ₂	G1
Me	4, 5-(OMe) ₂	G1
Me	4, 6-(OMe) ₂	G1
Me	5, 6-(OMe) ₂	G1
Me	3, 4-F ₂	G1
Me	3, 5-F ₂	G1
Me	3, 6-F ₂	G1
Me	4, 5-F ₂	G1
Me	4, 6-F ₂	G1
Me	5, 6-F ₂	G1
Me	4-Me-5-OMe	G1
Me	4-Me-6-OMe	G1
Me	4-Me-3-F	G1
Me	4-Me-5-F	G1
Me	4-Me-6-F	G1
Me	4-Me-5-Cl	G1
Me	4-Me-6-Cl	G1
Me	4-Me-6-Br	G1
Me	4-Me-6-Et	G1
Me	6-Me-4-OMe	G1
Me	6-Me-5-OMe	G1
Me	6-Me-3-F	G1
Me	6-Me-4-F	G1
Me	6-Me-5-F	G1
Me	6-Me-4-Cl	G1
Me	6-Me-5-Cl	G1
Me	6-Me-4-Br	G1
Me	6-Me-4-Et	G1
Me	4-OMe-3-F	G1
Me	4-OMe-5-F	G1
Me	4-OMe-6-F	G1
Me	4-OMe-5-Cl	G1
Me	4-OMe-6-Cl	G1
Me	4-OMe-6-Br	G1
Me	4-OMe-6-Et	G1
Me	4-F-5-Cl	G1
Me	4-F-6-Cl	G1
Me	4-F-6-Br	G1

Me	4-F-6-Et	G1
Me	4-Cl-6-Br	G1
Me	4-Cl-6-Et	G1
Me	4-Br-6-Et	G1
Et	H	G1
Et	3-Me	G1
Et	4-Me	G1
Et	5-Me	G1
Et	6-Me	G1
Et	4-Et	G1
Et	4-t-Bu	G1
Et	4-i-Pr	G1
Et	4-OMe	G1
Et	6-OMe	G1
Et	3-F	G1
Et	4-F	G1
Et	5-F	G1
Et	6-F	G1
Et	4-Cl	G1
Et	6-Cl	G1
Et	4-Br	G1
Et	4, 6-Me ₂	G1
Pr	H	G1
Pr	4-Me	G1
Pr	6-Me	G1
Pr	4-Et	G1
Pr	4-OMe	G1
Pr	4-F	G1
Pr	4-Cl	G1
Pr	4, 6-Me ₂	G1
i-Pr	H	G1
F	H	G1
F	4-Me	G1
F	6-Me	G1
F	4-Et	G1
F	4-OMe	G1
F	4-F	G1
F	4-Cl	G1
F	4, 6-Me ₂	G1
Cl	H	G1
Cl	3-Me	G1
Cl	4-Me	G1
Cl	5-Me	G1
Cl	6-Me	G1
Cl	4-Et	G1
Cl	4-t-Bu	G1
Cl	4-i-Pr	G1
Cl	4-OMe	G1
Cl	6-OMe	G1
Cl	3-F	G1
Cl	4-F	G1
Cl	5-F	G1
Cl	6-F	G1
Cl	4-Cl	G1
Cl	6-Cl	G1
Cl	4-Br	G1
Cl	4, 6-Me ₂	G1
Br	H	G1

Br	3-Me	G1
Br	4-Me	G1
Br	5-Me	G1
Br	6-Me	G1
Br	4-Et	G1
Br	4-t-Bu	G1
Br	4-i-Pr	G1
Br	4-OMe	G1
Br	6-OMe	G1
Br	3-F	G1
Br	4-F	G1
Br	5-F	G1
Br	6-F	G1
Br	4-Cl	G1
Br	6-Cl	G1
Br	4-Br	G1
Br	4, 6-Me ₂	G1
OMe	H	G1
SMe	H	G1
SMe	4-Me	G1
SMe	6-Me	G1
SMe	4-Et	G1
SMe	4-OMe	G1
SMe	4-F	G1
SMe	4-Cl	G1
SMe	4, 6-Me ₂	G1
CF ₃	H	G1
CN	H	G1
H	H	G2
H	3-Me	G2
H	4-Me	G2
H	5-Me	G2
H	6-Me	G2
H	4-Et	G2
H	4-t-Bu	G2
H	4-i-Pr	G2
H	4-CF ₃	G2
H	4-OMe	G2
H	6-OMe	G2
H	4-OEt	G2
H	4-SMe	G2
H	4-NMe ₂	G2
H	3-F	G2
H	4-F	G2
H	5-F	G2
H	6-F	G2
H	4-Cl	G2
H	6-Cl	G2
H	4-Br	G2
H	4-I	G2
H	4-CN	G2
H	4, 5-Me ₂	G2
H	4, 6-Me ₂	G2
H	4, 5-(OMe) ₂	G2
Me	H	G2
Me	3-Me	G2
Me	4-Me	G2
Me	5-Me	G2

Me	6-Me	G2
Me	3-Et	G2
Me	4-Et	G2
Me	5-Et	G2
Me	6-Et	G2
Me	4-t-Bu	G2
Me	4-i-Pr	G2
Me	3-CF ₃	G2
Me	4-CF ₃	G2
Me	5-CF ₃	G2
Me	6-CF ₃	G2
Me	3-OMe	G2
Me	4-OMe	G2
Me	5-OMe	G2
Me	6-OMe	G2
Me	3-OEt	G2
Me	4-OEt	G2
Me	5-OEt	G2
Me	6-OEt	G2
Me	3-SMe	G2
Me	4-SMe	G2
Me	5-SMe	G2
Me	6-SMe	G2
Me	3-NMe ₂	G2
Me	4-NMe ₂	G2
Me	5-NMe ₂	G2
Me	6-NMe ₂	G2
Me	3-F	G2
Me	4-F	G2
Me	5-F	G2
Me	6-F	G2
Me	3-Cl	G2
Me	4-Cl	G2
Me	5-Cl	G2
Me	6-Cl	G2
Me	3-Br	G2
Me	4-Br	G2
Me	5-Br	G2
Me	6-Br	G2
Me	3-I	G2
Me	4-I	G2
Me	5-I	G2
Me	6-I	G2
Me	3-CN	G2
Me	4-CN	G2
Me	5-CN	G2
Me	6-CN	G2
Me	4, 5-Me ₂	G2
Me	4, 6-Me ₂	G2
Me	5, 6-Me ₂	G2
Me	4, 5-Cl ₂	G2
Me	4, 6-Cl ₂	G2
Me	5, 6-Cl ₂	G2
Me	4, 5-(OMe) ₂	G2
Me	4, 6-(OMe) ₂	G2
Me	5, 6-(OMe) ₂	G2
Me	3, 4-F ₂	G2
Me	3, 5-F ₂	G2

Me	3, 6-F ₂	G2
Me	4, 5-F ₂	G2
Me	4, 6-F ₂	G2
Me	5, 6-F ₂	G2
Me	4-Me-5-OMe	G2
Me	4-Me-6-OMe	G2
Me	4-Me-3-F	G2
Me	4-Me-5-F	G2
Me	4-Me-6-F	G2
Me	4-Me-5-Cl	G2
Me	4-Me-6-Cl	G2
Me	4-Me-6-Br	G2
Me	4-Me-6-Et	G2
Me	6-Me-4-OMe	G2
Me	6-Me-5-OMe	G2
Me	6-Me-3-F	G2
Me	6-Me-4-F	G2
Me	6-Me-5-F	G2
Me	6-Me-4-Cl	G2
Me	6-Me-5-Cl	G2
Me	6-Me-4-Br	G2
Me	6-Me-4-Et	G2
Me	4-OMe-3-F	G2
Me	4-OMe-5-F	G2
Me	4-OMe-6-F	G2
Me	4-OMe-5-Cl	G2
Me	4-OMe-6-Cl	G2
Me	4-OMe-6-Br	G2
Me	4-OMe-6-Et	G2
Me	4-F-5-Cl	G2
Me	4-F-6-Cl	G2
Me	4-F-6-Br	G2
Me	4-F-6-Et	G2
Me	4-Cl-6-Br	G2
Me	4-Cl-6-Et	G2
Me	4-Br-6-Et	G2
Et	H	G2
Et	3-Me	G2
Et	4-Me	G2
Et	5-Me	G2
Et	6-Me	G2
Et	4-Et	G2
Et	4-t-Bu	G2
Et	4-i-Pr	G2
Et	4-OMe	G2
Et	6-OMe	G2
Et	3-F	G2
Et	4-F	G2
Et	5-F	G2
Et	6-F	G2
Et	4-Cl	G2
Et	6-Cl	G2
Et	4-Br	G2
Et	4, 6-Me ₂	G2
Pr	H	G2
Pr	4-Me	G2
Pr	6-Me	G2
Pr	4-Et	G2

Pr	4-OMe	G2
Pr	4-F	G2
Pr	4-Cl	G2
Pr	4, 6-Me ₂	G2
i-Pr	H	G2
F	H	G2
F	4-Me	G2
F	6-Me	G2
F	4-Et	G2
F	4-OMe	G2
F	4-F	G2
F	4-Cl	G2
F	4, 6-Me ₂	G2
Cl	H	G2
Cl	3-Me	G2
Cl	4-Me	G2
Cl	5-Me	G2
Cl	6-Me	G2
Cl	4-Et	G2
Cl	4-t-Bu	G2
Cl	4-i-Pr	G2
Cl	4-OMe	G2
Cl	6-OMe	G2
Cl	3-F	G2
Cl	4-F	G2
Cl	5-F	G2
Cl	6-F	G2
Cl	4-Cl	G2
Cl	6-Cl	G2
Cl	4-Br	G2
Cl	4, 6-Me ₂	G2
Br	H	G2
Br	3-Me	G2
Br	4-Me	G2
Br	5-Me	G2
Br	6-Me	G2
Br	4-Et	G2
Br	4-t-Bu	G2
Br	4-i-Pr	G2
Br	4-OMe	G2
Br	6-OMe	G2
Br	3-F	G2
Br	4-F	G2
Br	5-F	G2
Br	6-F	G2
Br	4-Cl	G2
Br	6-Cl	G2
Br	4-Br	G2
Br	4, 6-Me ₂	G2
OMe	H	G2
SMe	H	G2
SMe	4-Me	G2
SMe	6-Me	G2
SMe	4-Et	G2
SMe	4-OMe	G2
SMe	4-F	G2
SMe	4-Cl	G2
SMe	4, 6-Me ₂	G2

CF ₃	H	G2
CN	H	G2
H	H	G3
H	3-Me	G3
H	4-Me	G3
H	5-Me	G3
H	6-Me	G3
H	4-Et	G3
H	4-t-Bu	G3
H	4-i-Pr	G3
H	4-CF ₃	G3
H	4-OMe	G3
H	6-OMe	G3
H	4-OEt	G3
H	4-SMe	G3
H	4-NMe ₂	G3
H	3-F	G3
H	4-F	G3
H	5-F	G3
H	6-F	G3
H	4-Cl	G3
H	6-Cl	G3
H	4-Br	G3
H	4-I	G3
H	4-CN	G3
H	4, 5-Me ₂	G3
H	4, 6-Me ₂	G3
H	4, 5-(OMe) ₂	G3
Me	H	G3
Me	3-Me	G3
Me	4-Me	G3
Me	5-Me	G3
Me	6-Me	G3
Me	3-Et	G3
Me	4-Et	G3
Me	5-Et	G3
Me	6-Et	G3
Me	4-t-Bu	G3
Me	4-i-Pr	G3
Me	3-CF ₃	G3
Me	4-CF ₃	G3
Me	5-CF ₃	G3
Me	6-CF ₃	G3
Me	3-OMe	G3
Me	4-OMe	G3
Me	5-OMe	G3
Me	6-OMe	G3
Me	3-OEt	G3
Me	4-OEt	G3
Me	5-OEt	G3
Me	6-OEt	G3
Me	3-SMe	G3
Me	4-SMe	G3
Me	5-SMe	G3
Me	6-SMe	G3
Me	3-NMe ₂	G3
Me	4-NMe ₂	G3
Me	5-NMe ₂	G3

Me	6-NMe ₂	G3
Me	3-F	G3
Me	4-F	G3
Me	5-F	G3
Me	6-F	G3
Me	3-Cl	G3
Me	4-Cl	G3
Me	5-Cl	G3
Me	6-Cl	G3
Me	3-Br	G3
Me	4-Br	G3
Me	5-Br	G3
Me	6-Br	G3
Me	3-I	G3
Me	4-I	G3
Me	5-I	G3
Me	6-I	G3
Me	3-CN	G3
Me	4-CN	G3
Me	5-CN	G3
Me	6-CN	G3
Me	4, 5-Me ₂	G3
Me	4, 6-Me ₂	G3
Me	5, 6-Me ₂	G3
Me	4, 5-Cl ₂	G3
Me	4, 6-Cl ₂	G3
Me	5, 6-Cl ₂	G3
Me	4, 5-(OMe) ₂	G3
Me	4, 6-(OMe) ₂	G3
Me	5, 6-(OMe) ₂	G3
Me	3, 4-F ₂	G3
Me	3, 5-F ₂	G3
Me	3, 6-F ₂	G3
Me	4, 5-F ₂	G3
Me	4, 6-F ₂	G3
Me	5, 6-F ₂	G3
Me	4-Me-5-OMe	G3
Me	4-Me-6-OMe	G3
Me	4-Me-3-F	G3
Me	4-Me-5-F	G3
Me	4-Me-6-F	G3
Me	4-Me-5-Cl	G3
Me	4-Me-6-Cl	G3
Me	4-Me-6-Br	G3
Me	4-Me-6-Et	G3
Me	6-Me-4-OMe	G3
Me	6-Me-5-OMe	G3
Me	6-Me-3-F	G3
Me	6-Me-4-F	G3
Me	6-Me-5-F	G3
Me	6-Me-4-Cl	G3
Me	6-Me-5-Cl	G3
Me	6-Me-4-Br	G3
Me	6-Me-4-Et	G3
Me	4-OMe-3-F	G3
Me	4-OMe-5-F	G3
Me	4-OMe-6-F	G3
Me	4-OMe-5-Cl	G3

Me	4-OMe-6-Cl	G3
Me	4-OMe-6-Br	G3
Me	4-OMe-6-Et	G3
Me	4-F-5-Cl	G3
Me	4-F-6-Cl	G3
Me	4-F-6-Br	G3
Me	4-F-6-Et	G3
Me	4-Cl-6-Br	G3
Me	4-Cl-6-Et	G3
Me	4-Br-6-Et	G3
Et	H	G3
Et	3-Me	G3
Et	4-Me	G3
Et	5-Me	G3
Et	6-Me	G3
Et	4-Et	G3
Et	4-t-Bu	G3
Et	4-i-Pr	G3
Et	4-OMe	G3
Et	6-OMe	G3
Et	3-F	G3
Et	4-F	G3
Et	5-F	G3
Et	6-F	G3
Et	4-Cl	G3
Et	6-Cl	G3
Et	4-Br	G3
Et	4, 6-Me ₂	G3
Pr	H	G3
Pr	4-Me	G3
Pr	6-Me	G3
Pr	4-Et	G3
Pr	4-OMe	G3
Pr	4-F	G3
Pr	4-Cl	G3
Pr	4, 6-Me ₂	G3
i-Pr	H	G3
F	H	G3
F	4-Me	G3
F	6-Me	G3
F	4-Et	G3
F	4-OMe	G3
F	4-F	G3
F	4-Cl	G3
F	4, 6-Me ₂	G3
Cl	H	G3
Cl	3-Me	G3
Cl	4-Me	G3
Cl	5-Me	G3
Cl	6-Me	G3
Cl	4-Et	G3
Cl	4-t-Bu	G3
Cl	4-i-Pr	G3
Cl	4-OMe	G3
Cl	6-OMe	G3
Cl	3-F	G3
Cl	4-F	G3
Cl	5-F	G3

Cl	6-F	G3
Cl	4-Cl	G3
Cl	6-Cl	G3
Cl	4-Br	G3
Cl	4, 6-Me ₂	G3
Br	H	G3
Br	3-Me	G3
Br	4-Me	G3
Br	5-Me	G3
Br	6-Me	G3
Br	4-Et	G3
Br	4-t-Bu	G3
Br	4-i-Pr	G3
Br	4-OMe	G3
Br	6-OMe	G3
Br	3-F	G3
Br	4-F	G3
Br	5-F	G3
Br	6-F	G3
Br	4-Cl	G3
Br	6-Cl	G3
Br	4-Br	G3
Br	4, 6-Me ₂	G3
OMe	H	G3
SMe	H	G3
SMe	4-Me	G3
SMe	6-Me	G3
SMe	4-Et	G3
SMe	4-OMe	G3
SMe	4-F	G3
SMe	4-Cl	G3
SMe	4, 6-Me ₂	G3
CF ₃	H	G3
CN	H	G3
H	H	G4
H	3-Me	G4
H	4-Me	G4
H	5-Me	G4
H	6-Me	G4
H	4-Et	G4
H	4-t-Bu	G4
H	4-i-Pr	G4
H	4-CF ₃	G4
H	4-OMe	G4
H	6-OMe	G4
H	4-OEt	G4
H	4-SMe	G4
H	4-NMe ₂	G4
H	3-F	G4
H	4-F	G4
H	5-F	G4
H	6-F	G4
H	4-Cl	G4
H	6-Cl	G4
H	4-Br	G4
H	4-I	G4
H	4-CN	G4
H	4, 5-Me ₂	G4

H	4, 6-Me ₂	G4
H	4, 5-(OMe) ₂	G4
Me	H	G4
Me	3-Me	G4
Me	4-Me	G4
Me	5-Me	G4
Me	6-Me	G4
Me	3-Bt	G4
Me	4-Bt	G4
Me	5-Bt	G4
Me	6-Bt	G4
Me	4-t-Bu	G4
Me	4-i-Pr	G4
Me	3-CF ₃	G4
Me	4-CF ₃	G4
Me	5-CF ₃	G4
Me	6-CF ₃	G4
Me	3-OMe	G4
Me	4-OMe	G4
Me	5-OMe	G4
Me	6-OMe	G4
Me	3-OEt	G4
Me	4-OEt	G4
Me	5-OEt	G4
Me	6-OEt	G4
Me	3-SMe	G4
Me	4-SMe	G4
Me	5-SMe	G4
Me	6-SMe	G4
Me	3-NMe ₂	G4
Me	4-NMe ₂	G4
Me	5-NMe ₂	G4
Me	6-NMe ₂	G4
Me	3-F	G4
Me	4-F	G4
Me	5-F	G4
Me	6-F	G4
Me	3-Cl	G4
Me	4-Cl	G4
Me	5-Cl	G4
Me	6-Cl	G4
Me	3-Br	G4
Me	4-Br	G4
Me	5-Br	G4
Me	6-Br	G4
Me	3-I	G4
Me	4-I	G4
Me	5-I	G4
Me	6-I	G4
Me	3-CN	G4
Me	4-CN	G4
Me	5-CN	G4
Me	6-CN	G4
Me	4, 5-Me ₂	G4
Me	4, 6-Me ₂	G4
Me	5, 6-Me ₂	G4
Me	4, 5-Cl ₂	G4
Me	4, 6-Cl ₂	G4

Me	5, 6-Cl ₂	G4
Me	4, 5-(OMe) ₂	G4
Me	4, 6-(OMe) ₂	G4
Me	5, 6-(OMe) ₂	G4
Me	3, 4-F ₂	G4
Me	3, 5-F ₂	G4
Me	3, 6-F ₂	G4
Me	4, 5-F ₂	G4
Me	4, 6-F ₂	G4
Me	5, 6-F ₂	G4
Me	4-Me-5-OMe	G4
Me	4-Me-6-OMe	G4
Me	4-Me-3-F	G4
Me	4-Me-5-F	G4
Me	4-Me-6-F	G4
Me	4-Me-5-Cl	G4
Me	4-Me-6-Cl	G4
Me	4-Me-6-Br	G4
Me	4-Me-6-Et	G4
Me	6-Me-4-OMe	G4
Me	6-Me-5-OMe	G4
Me	6-Me-3-F	G4
Me	6-Me-4-F	G4
Me	6-Me-5-F	G4
Me	6-Me-4-Cl	G4
Me	6-Me-5-Cl	G4
Me	6-Me-4-Br	G4
Me	6-Me-4-Et	G4
Me	4-OMe-3-F	G4
Me	4-OMe-5-F	G4
Me	4-OMe-6-F	G4
Me	4-OMe-5-Cl	G4
Me	4-OMe-6-Cl	G4
Me	4-OMe-6-Br	G4
Me	4-OMe-6-Et	G4
Me	4-F-5-Cl	G4
Me	4-F-6-Cl	G4
Me	4-F-6-Br	G4
Me	4-F-6-Et	G4
Me	4-Cl-6-Br	G4
Me	4-Cl-6-Et	G4
Me	4-Br-6-Et	G4
Et	H	G4
Et	3-Me	G4
Et	4-Me	G4
Et	5-Me	G4
Et	6-Me	G4
Et	4-Et	G4
Et	4-t-Bu	G4
Et	4-i-Pr	G4
Et	4-OMe	G4
Et	6-OMe	G4
Et	3-F	G4
Et	4-F	G4
Et	5-F	G4
Et	6-F	G4
Et	4-Cl	G4
Et	6-Cl	G4

Et	4-Br	G4
Et	4, 6-Me ₂	G4
Pr	H	G4
Pr	4-Me	G4
Pr	6-Me	G4
Pr	4-Et	G4
Pr	4-OMe	G4
Pr	4-F	G4
Pr	4-Cl	G4
Pr	4, 6-Me ₂	G4
i-Pr	H	G4
F	H	G4
F	4-Me	G4
F	6-Me	G4
F	4-Et	G4
F	4-OMe	G4
F	4-F	G4
F	4-Cl	G4
F	4, 6-Me ₂	G4
Cl	H	G4
Cl	3-Me	G4
Cl	4-Me	G4
Cl	5-Me	G4
Cl	6-Me	G4
Cl	4-Et	G4
Cl	4-t-Bu	G4
Cl	4-i-Pr	G4
Cl	4-OMe	G4
Cl	6-OMe	G4
Cl	3-F	G4
Cl	4-F	G4
Cl	5-F	G4
Cl	6-F	G4
Cl	4-Cl	G4
Cl	6-Cl	G4
Cl	4-Br	G4
Cl	4, 6-Me ₂	G4
Br	H	G4
Br	3-Me	G4
Br	4-Me	G4
Br	5-Me	G4
Br	6-Me	G4
Br	4-Et	G4
Br	4-t-Bu	G4
Br	4-i-Pr	G4
Br	4-OMe	G4
Br	6-OMe	G4
Br	3-F	G4
Br	4-F	G4
Br	5-F	G4
Br	6-F	G4
Br	4-Cl	G4
Br	6-Cl	G4
Br	4-Br	G4
Br	4, 6-Me ₂	G4
OMe	H	G4
SMe	H	G4
SMe	4-Me	G4

SMe	6-Me	G4
SMe	4-Et	G4
SMe	4-OMe	G4
SMe	4-F	G4
SMe	4-Cl	G4
SMe	4, 6-Me ₂	G4
CF ₃	H	G4
CN	H	G4
H	H	G5
H	3-Me	G5
H	4-Me	G5
H	5-Me	G5
H	6-Me	G5
H	4-Et	G5
H	4-t-Bu	G5
H	4-i-Pr	G5
H	4-CF ₃	G5
H	4-OMe	G5
H	6-OMe	G5
H	4-OEt	G5
H	4-SMe	G5
H	4-NMe ₂	G5
H	3-F	G5
H	4-F	G5
H	5-F	G5
H	6-F	G5
H	4-Cl	G5
H	6-Cl	G5
H	4-Br	G5
H	4-I	G5
H	4-CN	G5
H	4, 5-Me ₂	G5
H	4, 6-Me ₂	G5
H	4, 5-(OMe) ₂	G5
Me	H	G5
Me	3-Me	G5
Me	4-Me	G5
Me	5-Me	G5
Me	6-Me	G5
Me	3-Et	G5
Me	4-Et	G5
Me	5-Et	G5
Me	6-Et	G5
Me	4-t-Bu	G5
Me	4-i-Pr	G5
Me	3-CF ₃	G5
Me	4-CF ₃	G5
Me	5-CF ₃	G5
Me	6-CF ₃	G5
Me	3-OMe	G5
Me	4-OMe	G5
Me	5-OMe	G5
Me	6-OMe	G5
Me	3-OEt	G5
Me	4-OEt	G5
Me	5-OEt	G5
Me	6-OEt	G5
Me	3-SMe	G5

Me	4-SMe	G5
Me	5-SMe	G5
Me	6-SMe	G5
Me	3-NMe ₂	G5
Me	4-NMe ₂	G5
Me	5-NMe ₂	G5
Me	6-NMe ₂	G5
Me	3-F	G5
Me	4-F	G5
Me	5-F	G5
Me	6-F	G5
Me	3-Cl	G5
Me	4-Cl	G5
Me	5-Cl	G5
Me	6-Cl	G5
Me	3-Br	G5
Me	4-Br	G5
Me	5-Br	G5
Me	6-Br	G5
Me	3-I	G5
Me	4-I	G5
Me	5-I	G5
Me	6-I	G5
Me	3-CN	G5
Me	4-CN	G5
Me	5-CN	G5
Me	6-CN	G5
Me	4, 5-Me ₂	G5
Me	4, 6-Me ₂	G5
Me	5, 6-Me ₂	G5
Me	4, 5-Cl ₂	G5
Me	4, 6-Cl ₂	G5
Me	5, 6-Cl ₂	G5
Me	4, 5-(OMe) ₂	G5
Me	4, 6-(OMe) ₂	G5
Me	5, 6-(OMe) ₂	G5
Me	3, 4-F ₂	G5
Me	3, 5-F ₂	G5
Me	3, 6-F ₂	G5
Me	4, 5-F ₂	G5
Me	4, 6-F ₂	G5
Me	5, 6-F ₂	G5
Me	4-Me-5-OMe	G5
Me	4-Me-6-OMe	G5
Me	4-Me-3-F	G5
Me	4-Me-5-F	G5
Me	4-Me-6-F	G5
Me	4-Me-5-Cl	G5
Me	4-Me-6-Cl	G5
Me	4-Me-6-Br	G5
Me	4-Me-6-Et	G5
Me	6-Me-4-OMe	G5
Me	6-Me-5-OMe	G5
Me	6-Me-3-F	G5
Me	6-Me-4-F	G5
Me	6-Me-5-F	G5
Me	6-Me-4-Cl	G5
Me	6-Me-5-Cl	G5

Me	6-Me-4-Br	G5
Me	6-Me-4-Et	G5
Me	4-OMe-3-F	G5
Me	4-OMe-5-F	G5
Me	4-OMe-6-F	G5
Me	4-OMe-5-Cl	G5
Me	4-OMe-6-Cl	G5
Me	4-OMe-6-Br	G5
Me	4-OMe-6-Et	G5
Me	4-F-5-Cl	G5
Me	4-F-6-Cl	G5
Me	4-F-6-Br	G5
Me	4-F-6-Et	G5
Me	4-Cl-6-Br	G5
Me	4-Cl-6-Et	G5
Me	4-Br-6-Et	G5
Et	H	G5
Et	3-Me	G5
Et	4-Me	G5
Et	5-Me	G5
Et	6-Me	G5
Bt	4-Bt	G5
Et	4-t-Bu	G5
Et	4-i-Pr	G5
Et	4-OMe	G5
Et	6-OMe	G5
Et	3-F	G5
Et	4-F	G5
Et	5-F	G5
Et	6-F	G5
Et	4-Cl	G5
Et	6-Cl	G5
Et	4-Br	G5
Et	4, 6-Me ₂	G5
Pr	H	G5
Pr	4-Me	G5
Pr	6-Me	G5
Pr	4-Bt	G5
Pr	4-OMe	G5
Pr	4-F	G5
Pr	4-Cl	G5
Pr	4, 6-Me ₂	G5
i-Pr	H	G5
F	H	G5
F	4-Me	G5
F	6-Me	G5
F	4-Bt	G5
F	4-OMe	G5
F	4-F	G5
F	4-Cl	G5
F	4, 6-Me ₂	G5
Cl	H	G5
Cl	3-Me	G5
Cl	4-Me	G5
Cl	5-Me	G5
Cl	6-Me	G5
Cl	4-Bt	G5
Cl	4-t-Bu	G5

Cl	4-i-Pr	G5
Cl	4-OMe	G5
Cl	6-OMe	G5
Cl	3-F	G5
Cl	4-F	G5
Cl	5-F	G5
Cl	6-F	G5
Cl	4-Cl	G5
Cl	6-Cl	G5
Cl	4-Br	G5
Cl	4, 6-Me ₂	G5
Br	H	G5
Br	3-Me	G5
Br	4-Me	G5
Br	5-Me	G5
Br	6-Me	G5
Br	4-Et	G5
Br	4-t-Bu	G5
Br	4-i-Pr	G5
Br	4-OMe	G5
Br	6-OMe	G5
Br	3-F	G5
Br	4-F	G5
Br	5-F	G5
Br	6-F	G5
Br	4-Cl	G5
Br	6-Cl	G5
Br	4-Br	G5
Br	4, 6-Me ₂	G5
OMe	H	G5
SMe	H	G5
SMe	4-Me	G5
SMe	6-Me	G5
SMe	4-Et	G5
SMe	4-OMe	G5
SMe	4-F	G5
SMe	4-Cl	G5
SMe	4, 6-Me ₂	G5
CF ₃	H	G5
CN	H	G6
H	H	G6
H	3-Me	G6
H	4-Me	G6
H	5-Me	G6
H	6-Me	G6
H	4-Et	G6
H	4-t-Bu	G6
H	4-i-Pr	G6
H	4-CF ₃	G6
H	4-OMe	G6
H	6-OMe	G6
H	4-OEt	G6
H	4-SMe	G6
H	4-NMe ₂	G6
H	3-F	G6
H	4-F	G6
H	5-F	G6
H	6-F	G6

H	4-Cl	G6
H	6-Cl	G6
H	4-Br	G6
H	4-I	G6
H	4-CN	G6
H	4, 5-Me ₂	G6
H	4, 6-Me ₂	G6
H	4, 5-(OMe) ₂	G6
Me	H	G6
Me	3-Me	G6
Me	4-Me	G6
Me	5-Me	G6
Me	6-Me	G6
Me	3-Et	G6
Me	4-Et	G6
Me	5-Et	G6
Me	6-Et	G6
Me	4-t-Bu	G6
Me	4-i-Pr	G6
Me	3-CF ₃	G6
Me	4-CF ₃	G6
Me	5-CF ₃	G6
Me	6-CF ₃	G6
Me	3-OMe	G6
Me	4-OMe	G6
Me	5-OMe	G6
Me	6-OMe	G6
Me	3-OEt	G6
Me	4-OEt	G6
Me	5-OEt	G6
Me	6-OEt	G6
Me	3-SMe	G6
Me	4-SMe	G6
Me	5-SMe	G6
Me	6-SMe	G6
Me	3-NMe ₂	G6
Me	4-NMe ₂	G6
Me	5-NMe ₂	G6
Me	6-NMe ₂	G6
Me	3-F	G6
Me	4-F	G6
Me	5-F	G6
Me	6-F	G6
Me	3-Cl	G6
Me	4-Cl	G6
Me	5-Cl	G6
Me	6-Cl	G6
Me	3-Br	G6
Me	4-Br	G6
Me	5-Br	G6
Me	6-Br	G6
Me	3-I	G6
Me	4-I	G6
Me	5-I	G6
Me	6-I	G6
Me	3-CN	G6
Me	4-CN	G6
Me	5-CN	G6

Me	6-CN	G6
Me	4, 5-Me ₂	G6
Me	4, 6-Me ₂	G6
Me	5, 6-Me ₂	G6
Me	4, 5-Cl ₂	G6
Me	4, 6-Cl ₂	G6
Me	5, 6-Cl ₂	G6
Me	4, 5-(OMe) ₂	G6
Me	4, 6-(OMe) ₂	G6
Me	5, 6-(OMe) ₂	G6
Me	3, 4-F ₂	G6
Me	3, 5-F ₂	G6
Me	3, 6-F ₂	G6
Me	4, 5-F ₂	G6
Me	4, 6-F ₂	G6
Me	5, 6-F ₂	G6
Me	4-Me-5-OMe	G6
Me	4-Me-6-OMe	G6
Me	4-Me-3-F	G6
Me	4-Me-5-F	G6
Me	4-Me-6-F	G6
Me	4-Me-5-Cl	G6
Me	4-Me-6-Cl	G6
Me	4-Me-6-Br	G6
Me	4-Me-6-Et	G6
Me	6-Me-4-OMe	G6
Me	6-Me-5-OMe	G6
Me	6-Me-3-F	G6
Me	6-Me-4-F	G6
Me	6-Me-5-F	G6
Me	6-Me-4-Cl	G6
Me	6-Me-5-Cl	G6
Me	6-Me-4-Br	G6
Me	6-Me-4-Et	G6
Me	4-OMe-3-F	G6
Me	4-OMe-5-F	G6
Me	4-OMe-6-F	G6
Me	4-OMe-5-Cl	G6
Me	4-OMe-6-Cl	G6
Me	4-OMe-6-Br	G6
Me	4-OMe-6-Et	G6
Me	4-F-5-Cl	G6
Me	4-F-6-Cl	G6
Me	4-F-6-Br	G6
Me	4-F-6-Et	G6
Me	4-Cl-6-Br	G6
Me	4-Cl-6-Et	G6
Me	4-Br-6-Et	G6
Et	H	G6
Et	3-Me	G6
Et	4-Me	G6
Et	5-Me	G6
Et	6-Me	G6
Et	4-Et	G6
Et	4-t-Bu	G6
Et	4-i-Pr	G6
Et	4-OMe	G6
Et	6-OMe	G6

Et	3-F	G6
Et	4-F	G6
Et	5-F	G6
Et	6-F	G6
Et	4-Cl	G6
Et	6-Cl	G6
Et	4-Br	G6
Et	4, 6-Me ₂	G6
Pr	H	G6
Pr	4-Me	G6
Pr	6-Me	G6
Pr	4-Et	G6
Pr	4-OMe	G6
Pr	4-F	G6
Pr	4-Cl	G6
Pr	4, 6-Me ₂	G6
i-Pr	H	G6
F	H	G6
F	4-Me	G6
F	6-Me	G6
F	4-Et	G6
F	4-OMe	G6
F	4-F	G6
F	4-Cl	G6
F	4, 6-Me ₂	G6
Cl	H	G6
Cl	3-Me	G6
Cl	4-Me	G6
Cl	5-Me	G6
Cl	6-Me	G6
Cl	4-Et	G6
Cl	4-t-Bu	G6
Cl	4-i-Pr	G6
Cl	4-OMe	G6
Cl	6-OMe	G6
Cl	3-F	G6
Cl	4-F	G6
Cl	5-F	G6
Cl	6-F	G6
Cl	4-Cl	G6
Cl	6-Cl	G6
Cl	4-Br	G6
Cl	4, 6-Me ₂	G6
Br	H	G6
Br	3-Me	G6
Br	4-Me	G6
Br	5-Me	G6
Br	6-Me	G6
Br	4-Et	G6
Br	4-t-Bu	G6
Br	4-i-Pr	G6
Br	4-OMe	G6
Br	6-OMe	G6
Br	3-F	G6
Br	4-F	G6
Br	5-F	G6
Br	6-F	G6
Br	4-Cl	G6

Br	6-Cl	G6
Br	4-Br	G6
Br	4, 6-Me ₂	G6
OMe	H	G6
SMe	H	G6
SMe	4-Me	G6
SMe	6-Me	G6
SMe	4-Et	G6
SMe	4-OMe	G6
SMe	4-F	G6
SMe	4-Cl	G6
SMe	4, 6-Me ₂	G6
CF ₃	H	G6
CN	H	G6
H	H	G7
H	3-Me	G7
H	4-Me	G7
H	5-Me	G7
H	6-Me	G7
H	4-Et	G7
H	4-t-Bu	G7
H	4-i-Pr	G7
H	4-CF ₃	G7
H	4-OMe	G7
H	6-OMe	G7
H	4-OEt	G7
H	4-SMe	G7
H	4-NMe ₂	G7
H	3-F	G7
H	4-F	G7
H	5-F	G7
H	6-F	G7
H	4-Cl	G7
H	6-Cl	G7
H	4-Br	G7
H	4-I	G7
H	4-CN	G7
H	4, 5-Me ₂	G7
H	4, 6-Me ₂	G7
H	4, 5-(OMe) ₂	G7
Me	H	G7
Me	3-Me	G7
Me	4-Me	G7
Me	5-Me	G7
Me	6-Me	G7
Me	3-Et	G7
Me	4-Et	G7
Me	5-Et	G7
Me	6-Et	G7
Me	4-t-Bu	G7
Me	4-i-Pr	G7
Me	3-CF ₃	G7
Me	4-CF ₃	G7
Me	5-CF ₃	G7
Me	6-CF ₃	G7
Me	3-OMe	G7
Me	4-OMe	G7
Me	5-OMe	G7

Me	6-OMe	G7
Me	3-OEt	G7
Me	4-OEt	G7
Me	5-OEt	G7
Me	6-OEt	G7
Me	3-SMe	G7
Me	4-SMe	G7
Me	5-SMe	G7
Me	6-SMe	G7
Me	3-NMe ₂	G7
Me	4-NMe ₂	G7
Me	5-NMe ₂	G7
Me	6-NMe ₂	G7
Me	3-F	G7
Me	4-F	G7
Me	5-F	G7
Me	6-F	G7
Me	3-Cl	G7
Me	4-Cl	G7
Me	5-Cl	G7
Me	6-Cl	G7
Me	3-Br	G7
Me	4-Br	G7
Me	5-Br	G7
Me	6-Br	G7
Me	3-I	G7
Me	4-I	G7
Me	5-I	G7
Me	6-I	G7
Me	3-CN	G7
Me	4-CN	G7
Me	5-CN	G7
Me	6-CN	G7
Me	4, 5-Me ₂	G7
Me	4, 6-Me ₂	G7
Me	5, 6-Me ₂	G7
Me	4, 5-Cl ₂	G7
Me	4, 6-Cl ₂	G7
Me	5, 6-Cl ₂	G7
Me	4, 5-(OMe) ₂	G7
Me	4, 6-(OMe) ₂	G7
Me	5, 6-(OMe) ₂	G7
Me	3, 4-F ₂	G7
Me	3, 5-F ₂	G7
Me	3, 6-F ₂	G7
Me	4, 5-F ₂	G7
Me	4, 6-F ₂	G7
Me	5, 6-F ₂	G7
Me	4-Me-5-OMe	G7
Me	4-Me-6-OMe	G7
Me	4-Me-3-F	G7
Me	4-Me-5-F	G7
Me	4-Me-6-F	G7
Me	4-Me-5-Cl	G7
Me	4-Me-6-Cl	G7
Me	4-Me-6-Br	G7
Me	4-Me-6-Et	G7
Me	6-Me-4-OMe	G7

Me	6-Me-5-OMe	G7
Me	6-Me-3-F	G7
Me	6-Me-4-F	G7
Me	6-Me-5-F	G7
Me	6-Me-4-Cl	G7
Me	6-Me-5-Cl	G7
Me	6-Me-4-Br	G7
Me	6-Me-4-Et	G7
Me	4-OMe-3-F	G7
Me	4-OMe-5-F	G7
Me	4-OMe-6-F	G7
Me	4-OMe-5-Cl	G7
Me	4-OMe-6-Cl	G7
Me	4-OMe-6-Br	G7
Me	4-OMe-6-Et	G7
Me	4-F-5-Cl	G7
Me	4-F-6-Cl	G7
Me	4-F-6-Br	G7
Me	4-F-6-Et	G7
Me	4-Cl-6-Br	G7
Me	4-Cl-6-Et	G7
Me	4-Br-6-Et	G7
Et	H	G7
Et	3-Me	G7
Et	4-Me	G7
Et	5-Me	G7
Et	6-Me	G7
Et	4-Et	G7
Et	4-t-Bu	G7
Et	4-i-Pr	G7
Et	4-OMe	G7
Et	6-OMe	G7
Et	3-F	G7
Et	4-F	G7
Et	5-F	G7
Et	6-F	G7
Et	4-Cl	G7
Et	6-Cl	G7
Et	4-Br	G7
Et	4, 6-Me ₂	G7
Pr	H	G7
Pr	4-Me	G7
Pr	6-Me	G7
Pr	4-Et	G7
Pr	4-OMe	G7
Pr	4-F	G7
Pr	4-Cl	G7
Pr	4, 6-Me ₂	G7
i-Pr	H	G7
F	H	G7
F	4-Me	G7
F	6-Me	G7
F	4-Et	G7
F	4-OMe	G7
F	4-F	G7
F	4-Cl	G7
F	4, 6-Me ₂	G7
Cl	H	G7

Cl	3-Me	G7
Cl	4-Me	G7
Cl	5-Me	G7
Cl	6-Me	G7
Cl	4-Et	G7
Cl	4-t-Bu	G7
Cl	4-i-Pr	G7
Cl	4-OMe	G7
Cl	6-OMe	G7
Cl	3-F	G7
Cl	4-F	G7
Cl	5-F	G7
Cl	6-F	G7
Cl	4-Cl	G7
Cl	6-Cl	G7
Cl	4-Br	G7
Cl	4, 6-Me ₂	G7
Br	H	G7
Br	3-Me	G7
Br	4-Me	G7
Br	5-Me	G7
Br	6-Me	G7
Br	4-Et	G7
Br	4-t-Bu	G7
Br	4-i-Pr	G7
Br	4-OMe	G7
Br	6-OMe	G7
Br	3-F	G7
Br	4-F	G7
Br	5-F	G7
Br	6-F	G7
Br	4-Cl	G7
Br	6-Cl	G7
Br	4-Br	G7
Br	4, 6-Me ₂	G7
OMe	H	G7
SMe	H	G7
SMe	4-Me	G7
SMe	6-Me	G7
SMe	4-Et	G7
SMe	4-OMe	G7
SMe	4-F	G7
SMe	4-Cl	G7
SMe	4, 6-Me ₂	G7
CF ₃	H	G7
CN	H	G8
H	3-Me	G8
H	4-Me	G8
H	5-Me	G8
H	6-Me	G8
H	4-Et	G8
H	4-t-Bu	G8
H	4-i-Pr	G8
H	4-CF ₃	G8
H	4-OMe	G8
H	6-OMe	G8
H	4-OEt	G8

H	4-SMe	G8
H	4-NMe ₂	G8
H	3-F	G8
H	4-F	G8
H	5-F	G8
H	6-F	G8
H	4-Cl	G8
H	6-Cl	G8
H	4-Br	G8
H	4-I	G8
H	4-CN	G8
H	4, 5-Me ₂	G8
H	4, 6-Me ₂	G8
H	4, 5-(OMe) ₂	G8
Me	H	G8
Me	3-Me	G8
Me	4-Me	G8
Me	5-Me	G8
Me	6-Me	G8
Me	3-Et	G8
Me	4-Et	G8
Me	5-Et	G8
Me	6-Et	G8
Me	4-t-Bu	G8
Me	4-i-Pr	G8
Me	3-CF ₃	G8
Me	4-CF ₃	G8
Me	5-CF ₃	G8
Me	6-CF ₃	G8
Me	3-OMe	G8
Me	4-OMe	G8
Me	5-OMe	G8
Me	6-OMe	G8
Me	3-OEt	G8
Me	4-OEt	G8
Me	5-OEt	G8
Me	6-OEt	G8
Me	3-SMe	G8
Me	4-SMe	G8
Me	5-SMe	G8
Me	6-SMe	G8
Me	3-NMe ₂	G8
Me	4-NMe ₂	G8
Me	5-NMe ₂	G8
Me	6-NMe ₂	G8
Me	3-F	G8
Me	4-F	G8
Me	5-F	G8
Me	6-F	G8
Me	3-Cl	G8
Me	4-Cl	G8
Me	5-Cl	G8
Me	6-Cl	G8
Me	3-Br	G8
Me	4-Br	G8
Me	5-Br	G8
Me	6-Br	G8
Me	3-I	G8

Me	4-I	G8
Me	5-I	G8
Me	6-I	G8
Me	3-CN	G8
Me	4-CN	G8
Me	5-CN	G8
Me	6-CN	G8
Me	4, 5-Me ₂	G8
Me	4, 6-Me ₂	G8
Me	5, 6-Me ₂	G8
Me	4, 5-Cl ₂	G8
Me	4, 6-Cl ₂	G8
Me	5, 6-Cl ₂	G8
Me	4, 5-(OMe) ₂	G8
Me	4, 6-(OMe) ₂	G8
Me	5, 6-(OMe) ₂	G8
Me	3, 4-F ₂	G8
Me	3, 5-F ₂	G8
Me	3, 6-F ₂	G8
Me	4, 5-F ₂	G8
Me	4, 6-F ₂	G8
Me	5, 6-F ₂	G8
Me	4-Me-5-OMe	G8
Me	4-Me-6-OMe	G8
Me	4-Me-3-F	G8
Me	4-Me-5-F	G8
Me	4-Me-6-F	G8
Me	4-Me-5-Cl	G8
Me	4-Me-6-Cl	G8
Me	4-Me-6-Br	G8
Me	4-Me-6-Et	G8
Me	6-Me-4-OMe	G8
Me	6-Me-5-OMe	G8
Me	6-Me-3-F	G8
Me	6-Me-4-F	G8
Me	6-Me-5-F	G8
Me	6-Me-4-Cl	G8
Me	6-Me-5-Cl	G8
Me	6-Me-4-Br	G8
Me	6-Me-4-Et	G8
Me	4-OMe-3-F	G8
Me	4-OMe-5-F	G8
Me	4-OMe-6-F	G8
Me	4-OMe-5-Cl	G8
Me	4-OMe-6-Cl	G8
Me	4-OMe-6-Br	G8
Me	4-OMe-6-Et	G8
Me	4-F-5-Cl	G8
Me	4-F-6-Cl	G8
Me	4-F-6-Br	G8
Me	4-F-6-Et	G8
Me	4-Cl-6-Br	G8
Me	4-Cl-6-Et	G8
Me	4-Br-6-Et	G8
Et	H	G8
Et	3-Me	G8
Et	4-Me	G8
Et	5-Me	G8

Et	6-Me	G8
Et	4-Et	G8
Et	4-t-Bu	G8
Et	4-i-Pr	G8
Et	4-OMe	G8
Et	6-OMe	G8
Et	3-F	G8
Et	4-F	G8
Et	5-F	G8
Et	6-F	G8
Et	4-Cl	G8
Et	6-Cl	G8
Et	4-Br	G8
Et	4, 6-Me ₂	G8
Pr	H	G8
Pr	4-Me	G8
Pr	6-Me	G8
Pr	4-Et	G8
Pr	4-OMe	G8
Pr	4-F	G8
Pr	4-Cl	G8
Pr	4, 6-Me ₂	G8
i-Pr	H	G8
F	H	G8
F	4-Me	G8
F	6-Me	G8
F	4-Et	G8
F	4-OMe	G8
F	4-F	G8
F	4-Cl	G8
F	4, 6-Me ₂	G8
Cl	H	G8
Cl	3-Me	G8
Cl	4-Me	G8
Cl	5-Me	G8
Cl	6-Me	G8
Cl	4-Et	G8
Cl	4-t-Bu	G8
Cl	4-i-Pr	G8
Cl	4-OMe	G8
Cl	6-OMe	G8
Cl	3-F	G8
Cl	4-F	G8
Cl	5-F	G8
Cl	6-F	G8
Cl	4-Cl	G8
Cl	6-Cl	G8
Cl	4-Br	G8
Cl	4, 6-Me ₂	G8
Br	H	G8
Br	3-Me	G8
Br	4-Me	G8
Br	5-Me	G8
Br	6-Me	G8
Br	4-Et	G8
Br	4-t-Bu	G8
Br	4-i-Pr	G8
Br	4-OMe	G8

Br	6-OMe	G8
Br	3-F	G8
Br	4-F	G8
Br	5-F	G8
Br	6-F	G8
Br	4-Cl	G8
Br	6-Cl	G8
Br	4-Br	G8
Br	4, 6-Me ₂	G8
OMe	H	G8
SMe	H	G8
SMe	4-Me	G8
SMe	6-Me	G8
SMe	4-Et	G8
SMe	4-OMe	G8
SMe	4-F	G8
SMe	4-Cl	G8
SMe	4, 6-Me ₂	G8
CF ₃	H	G8
CN	H	G8
H	H	G9
H	3-Me	G9
H	4-Me	G9
H	5-Me	G9
H	6-Me	G9
H	4-Et	G9
H	4-t-Bu	G9
H	4-i-Pr	G9
H	4-CF ₃	G9
H	4-OMe	G9
H	6-OMe	G9
H	4-OEt	G9
H	4-SMe	G9
H	4-NMe ₂	G9
H	3-F	G9
H	4-F	G9
H	5-F	G9
H	6-F	G9
H	4-Cl	G9
H	6-Cl	G9
H	4-Br	G9
H	4-I	G9
H	4-CN	G9
H	4, 5-Me ₂	G9
H	4, 6-Me ₂	G9
H	4, 5-(OMe) ₂	G9
Me	H	G9
Me	3-Me	G9
Me	4-Me	G9
Me	5-Me	G9
Me	6-Me	G9
Me	3-Et	G9
Me	4-Et	G9
Me	5-Et	G9
Me	6-Et	G9
Me	4-t-Bu	G9
Me	4-i-Pr	G9
Me	3-CF ₃	G9

Me	4-CF ₃	G9
Me	5-CF ₃	G9
Me	6-CF ₃	G9
Me	3-OMe	G9
Me	4-OMe	G9
Me	5-OMe	G9
Me	6-OMe	G9
Me	3-OEt	G9
Me	4-OEt	G9
Me	5-OEt	G9
Me	6-OEt	G9
Me	3-SMe	G9
Me	4-SMe	G9
Me	5-SMe	G9
Me	6-SMe	G9
Me	3-NMe ₂	G9
Me	4-NMe ₂	G9
Me	5-NMe ₂	G9
Me	6-NMe ₂	G9
Me	3-F	G9
Me	4-F	G9
Me	5-F	G9
Me	6-F	G9
Me	3-Cl	G9
Me	4-Cl	G9
Me	5-Cl	G9
Me	6-Cl	G9
Me	3-Br	G9
Me	4-Br	G9
Me	5-Br	G9
Me	6-Br	G9
Me	3-I	G9
Me	4-I	G9
Me	5-I	G9
Me	6-I	G9
Me	3-CN	G9
Me	4-CN	G9
Me	5-CN	G9
Me	6-CN	G9
Me	4, 5-Me ₂	G9
Me	4, 6-Me ₂	G9
Me	5, 6-Me ₂	G9
Me	4, 5-Cl ₂	G9
Me	4, 6-Cl ₂	G9
Me	5, 6-Cl ₂	G9
Me	4, 5-(OMe) ₂	G9
Me	4, 6-(OMe) ₂	G9
Me	5, 6-(OMe) ₂	G9
Me	3, 4-F ₂	G9
Me	3, 5-F ₂	G9
Me	3, 6-F ₂	G9
Me	4, 5-F ₂	G9
Me	4, 6-F ₂	G9
Me	5, 6-F ₂	G9
Me	4-Me-5-OMe	G9
Me	4-Me-6-OMe	G9
Me	4-Me-3-F	G9
Me	4-Me-5-F	G9

Me	4-Me-6-F	G9
Me	4-Me-5-Cl	G9
Me	4-Me-6-Cl	G9
Me	4-Me-6-Br	G9
Me	4-Me-6-Et	G9
Me	6-Me-4-OMe	G9
Me	6-Me-5-OMe	G9
Me	6-Me-3-F	G9
Me	6-Me-4-F	G9
Me	6-Me-5-F	G9
Me	6-Me-4-Cl	G9
Me	6-Me-5-Cl	G9
Me	6-Me-4-Br	G9
Me	6-Me-4-Et	G9
Me	4-OMe-3-F	G9
Me	4-OMe-5-F	G9
Me	4-OMe-6-F	G9
Me	4-OMe-5-Cl	G9
Me	4-OMe-6-Cl	G9
Me	4-OMe-6-Br	G9
Me	4-OMe-6-Et	G9
Me	4-F-5-Cl	G9
Me	4-F-6-Cl	G9
Me	4-F-6-Br	G9
Me	4-F-6-Et	G9
Me	4-Cl-6-Br	G9
Me	4-Cl-6-Et	G9
Me	4-Br-6-Et	G9
Et	H	G9
Et	3-Me	G9
Et	4-Me	G9
Et	5-Me	G9
Et	6-Me	G9
Et	4-Et	G9
Et	4-t-Bu	G9
Et	4-i-Pr	G9
Et	4-OMe	G9
Et	6-OMe	G9
Et	3-F	G9
Et	4-F	G9
Et	5-F	G9
Et	6-F	G9
Et	4-Cl	G9
Et	6-Cl	G9
Et	4-Br	G9
Et	4, 6-Me ₂	G9
Pr	H	G9
Pr	4-Me	G9
Pr	6-Me	G9
Pr	4-Et	G9
Pr	4-OMe	G9
Pr	4-F	G9
Pr	4-Cl	G9
Pr	4, 6-Me ₂	G9
i-Pr	H	G9
F	H	G9
F	4-Me	G9
F	6-Me	G9

F	4-Et	G9
F	4-OMe	G9
F	4-F	G9
F	4-Cl	G9
F	4, 6-Me ₂	G9
Cl	H	G9
Cl	3-Me	G9
Cl	4-Me	G9
Cl	5-Me	G9
Cl	6-Me	G9
Cl	4-Et	G9
Cl	4-t-Bu	G9
Cl	4-i-Pr	G9
Cl	4-OMe	G9
Cl	6-OMe	G9
Cl	3-F	G9
Cl	4-F	G9
Cl	5-F	G9
Cl	6-F	G9
Cl	4-Cl	G9
Cl	6-Cl	G9
Cl	4-Br	G9
Cl	4, 6-Me ₂	G9
Br	H	G9
Br	3-Me	G9
Br	4-Me	G9
Br	5-Me	G9
Br	6-Me	G9
Br	4-Et	G9
Br	4-t-Bu	G9
Br	4-i-Pr	G9
Br	4-OMe	G9
Br	6-OMe	G9
Br	3-F	G9
Br	4-F	G9
Br	5-F	G9
Br	6-F	G9
Br	4-Cl	G9
Br	6-Cl	G9
Br	4-Br	G9
Br	4, 6-Me ₂	G9
OMe	H	G9
SMe	H	G9
SMe	4-Me	G9
SMe	6-Me	G9
SMe	4-Et	G9
SMe	4-OMe	G9
SMe	4-F	G9
SMe	4-Cl	G9
SMe	4, 6-Me ₂	G9
CF ₃	H	G9
CN	H	G10
H	H	G10
H	3-Me	G10
H	4-Me	G10
H	5-Me	G10
H	6-Me	G10
H	4-Et	G10

H	4-t-Bu	G10
H	4-i-Pr	G10
H	4-CF ₃	G10
H	4-OMe	G10
H	6-OMe	G10
H	4-OEt	G10
H	4-SMe	G10
H	4-NMe ₂	G10
H	3-F	G10
H	4-F	G10
H	5-F	G10
H	6-F	G10
H	4-Cl	G10
H	6-Cl	G10
H	4-Br	G10
H	4-I	G10
H	4-CN	G10
H	4, 5-Me ₂	G10
H	4, 6-Me ₂	G10
H	4, 5-(OMe) ₂	G10
Me	H	G10
Me	3-Me	G10
Me	4-Me	G10
Me	5-Me	G10
Me	6-Me	G10
Me	3-Et	G10
Me	4-Et	G10
Me	5-Et	G10
Me	6-Et	G10
Me	4-t-Bu	G10
Me	4-i-Pr	G10
Me	3-CF ₃	G10
Me	4-CF ₃	G10
Me	5-CF ₃	G10
Me	6-CF ₃	G10
Me	3-OMe	G10
Me	4-OMe	G10
Me	5-OMe	G10
Me	6-OMe	G10
Me	3-OEt	G10
Me	4-OEt	G10
Me	5-OEt	G10
Me	6-OEt	G10
Me	3-SMe	G10
Me	4-SMe	G10
Me	5-SMe	G10
Me	6-SMe	G10
Me	3-NMe ₂	G10
Me	4-NMe ₂	G10
Me	5-NMe ₂	G10
Me	6-NMe ₂	G10
Me	3-F	G10
Me	4-F	G10
Me	5-F	G10
Me	6-F	G10
Me	3-Cl	G10
Me	4-Cl	G10
Me	5-Cl	G10

Me	6-Cl	G10
Me	3-Br	G10
Me	4-Br	G10
Me	5-Br	G10
Me	6-Br	G10
Me	3-I	G10
Me	4-I	G10
Me	5-I	G10
Me	6-I	G10
Me	3-CN	G10
Me	4-CN	G10
Me	5-CN	G10
Me	6-CN	G10
Me	4, 5-Me ₂	G10
Me	4, 6-Me ₂	G10
Me	5, 6-Me ₂	G10
Me	4, 5-Cl ₂	G10
Me	4, 6-Cl ₂	G10
Me	5, 6-Cl ₂	G10
Me	4, 5-(OMe) ₂	G10
Me	4, 6-(OMe) ₂	G10
Me	5, 6-(OMe) ₂	G10
Me	3, 4-F ₂	G10
Me	3, 5-F ₂	G10
Me	3, 6-F ₂	G10
Me	4, 5-F ₂	G10
Me	4, 6-F ₂	G10
Me	5, 6-F ₂	G10
Me	4-Me-5-OMe	G10
Me	4-Me-6-OMe	G10
Me	4-Me-3-F	G10
Me	4-Me-5-F	G10
Me	4-Me-6-F	G10
Me	4-Me-5-Cl	G10
Me	4-Me-6-Cl	G10
Me	4-Me-6-Br	G10
Me	4-Me-6-Et	G10
Me	6-Me-4-OMe	G10
Me	6-Me-5-OMe	G10
Me	6-Me-3-F	G10
Me	6-Me-4-F	G10
Me	6-Me-5-F	G10
Me	6-Me-4-Cl	G10
Me	6-Me-5-Cl	G10
Me	6-Me-4-Br	G10
Me	6-Me-4-Et	G10
Me	4-OMe-3-F	G10
Me	4-OMe-5-F	G10
Me	4-OMe-6-F	G10
Me	4-OMe-5-Cl	G10
Me	4-OMe-6-Cl	G10
Me	4-OMe-6-Br	G10
Me	4-OMe-6-Et	G10
Me	4-F-5-Cl	G10
Me	4-F-6-Cl	G10
Me	4-F-6-Br	G10
Me	4-F-6-Et	G10
Me	4-Cl-6-Br	G10

Me	4-Cl-6-Et	G10
Me	4-Br-6-Et	G10
Et	H	G10
Et	3-Me	G10
Et	4-Me	G10
Et	5-Me	G10
Et	6-Me	G10
Et	4-Et	G10
Et	4-t-Bu	G10
Et	4-i-Pr	G10
Et	4-OMe	G10
Et	6-OMe	G10
Et	3-F	G10
Et	4-F	G10
Et	5-F	G10
Et	6-F	G10
Et	4-Cl	G10
Et	6-Cl	G10
Et	4-Br	G10
Et	4, 6-Me ₂	G10
Pr	H	G10
Pr	4-Me	G10
Pr	6-Me	G10
Pr	4-Et	G10
Pr	4-OMe	G10
Pr	4-F	G10
Pr	4-Cl	G10
Pr	4, 6-Me ₂	G10
i-Pr	H	G10
F	H	G10
F	4-Me	G10
F	6-Me	G10
F	4-Et	G10
F	4-OMe	G10
F	4-F	G10
F	4-Cl	G10
F	4, 6-Me ₂	G10
Cl	H	G10
Cl	3-Me	G10
Cl	4-Me	G10
Cl	5-Me	G10
Cl	6-Me	G10
Cl	4-Et	G10
Cl	4-t-Bu	G10
Cl	4-i-Pr	G10
Cl	4-OMe	G10
Cl	6-OMe	G10
Cl	3-F	G10
Cl	4-F	G10
Cl	5-F	G10
Cl	6-F	G10
Cl	4-Cl	G10
Cl	6-Cl	G10
Cl	4-Br	G10
Cl	4, 6-Me ₂	G10
Br	H	G10
Br	3-Me	G10
Br	4-Me	G10

Br	5-Me	G10
Br	6-Me	G10
Br	4-Et	G10
Br	4-t-Bu	G10
Br	4-i-Pr	G10
Br	4-OMe	G10
Br	6-OMe	G10
Br	3-F	G10
Br	4-F	G10
Br	5-F	G10
Br	6-F	G10
Br	4-Cl	G10
Br	6-Cl	G10
Br	4-Br	G10
Br	4, 6-Me ₂	G10
OMe	H	G10
SMe	H	G10
SMe	4-Me	G10
SMe	6-Me	G10
SMe	4-Et	G10
SMe	4-OMe	G10
SMe	4-F	G10
SMe	4-Cl	G10
SMe	4, 6-Me ₂	G10
CF ₃	H	G10
CN	H	G11
H	H	G11
H	3-Me	G11
H	4-Me	G11
H	5-Me	G11
H	6-Me	G11
H	4-Et	G11
H	4-t-Bu	G11
H	4-i-Pr	G11
H	4-CF ₃	G11
H	4-OMe	G11
H	6-OMe	G11
H	4-OEt	G11
H	4-SMe	G11
H	4-NMe ₂	G11
H	3-F	G11
H	4-F	G11
H	5-F	G11
H	6-F	G11
H	4-Cl	G11
H	6-Cl	G11
H	4-Br	G11
H	4-I	G11
H	4-CN	G11
H	4, 5-Me ₂	G11
H	4, 6-Me ₂	G11
H	4, 5-(OMe) ₂	G11
Me	H	G11
Me	3-Me	G11
Me	4-Me	G11
Me	5-Me	G11
Me	6-Me	G11
Me	3-Et	G11

Me	4-Et	G11
Me	5-Et	G11
Me	6-Et	G11
Me	4-t-Bu	G11
Me	4-i-Pr	G11
Me	3-CF ₃	G11
Me	4-CF ₃	G11
Me	5-CF ₃	G11
Me	6-CF ₃	G11
Me	3-OMe	G11
Me	4-OMe	G11
Me	5-OMe	G11
Me	6-OMe	G11
Me	3-OEt	G11
Me	4-OEt	G11
Me	5-OEt	G11
Me	6-OEt	G11
Me	3-SMe	G11
Me	4-SMe	G11
Me	5-SMe	G11
Me	6-SMe	G11
Me	3-NMe ₂	G11
Me	4-NMe ₂	G11
Me	5-NMe ₂	G11
Me	6-NMe ₂	G11
Me	3-F	G11
Me	4-F	G11
Me	5-F	G11
Me	6-F	G11
Me	3-Cl	G11
Me	4-Cl	G11
Me	5-Cl	G11
Me	6-Cl	G11
Me	3-Br	G11
Me	4-Br	G11
Me	5-Br	G11
Me	6-Br	G11
Me	3-I	G11
Me	4-I	G11
Me	5-I	G11
Me	6-I	G11
Me	3-CN	G11
Me	4-CN	G11
Me	5-CN	G11
Me	6-CN	G11
Me	4, 5-Me ₂	G11
Me	4, 6-Me ₂	G11
Me	5, 6-Me ₂	G11
Me	4, 5-Cl ₂	G11
Me	4, 6-Cl ₂	G11
Me	5, 6-Cl ₂	G11
Me	4, 5-(OMe) ₂	G11
Me	4, 6-(OMe) ₂	G11
Me	5, 6-(OMe) ₂	G11
Me	3, 4-F ₂	G11
Me	3, 5-F ₂	G11
Me	3, 6-F ₂	G11
Me	4, 5-F ₂	G11

Me	4, 6-F ₂	G11
Me	5, 6-F ₂	G11
Me	4-Me-5-OMe	G11
Me	4-Me-6-OMe	G11
Me	4-Me-3-F	G11
Me	4-Me-5-F	G11
Me	4-Me-6-F	G11
Me	4-Me-5-Cl	G11
Me	4-Me-6-Cl	G11
Me	4-Me-6-Br	G11
Me	4-Me-6-Et	G11
Me	6-Me-4-OMe	G11
Me	6-Me-5-OMe	G11
Me	6-Me-3-F	G11
Me	6-Me-4-F	G11
Me	6-Me-5-F	G11
Me	6-Me-4-Cl	G11
Me	6-Me-5-Cl	G11
Me	6-Me-4-Br	G11
Me	6-Me-4-Et	G11
Me	4-OMe-3-F	G11
Me	4-OMe-5-F	G11
Me	4-OMe-6-F	G11
Me	4-OMe-5-Cl	G11
Me	4-OMe-6-Cl	G11
Me	4-OMe-6-Br	G11
Me	4-OMe-6-Et	G11
Me	4-F-5-Cl	G11
Me	4-F-6-Cl	G11
Me	4-F-6-Br	G11
Me	4-F-6-Et	G11
Me	4-Cl-6-Br	G11
Me	4-Cl-6-Et	G11
Me	4-Br-6-Et	G11
Et	H	G11
Et	3-Me	G11
Et	4-Me	G11
Et	5-Me	G11
Et	6-Me	G11
Et	4-Et	G11
Et	4-t-Bu	G11
Et	4-i-Pr	G11
Et	4-OMe	G11
Et	6-OMe	G11
Et	3-F	G11
Et	4-F	G11
Et	5-F	G11
Et	6-F	G11
Et	4-Cl	G11
Et	6-Cl	G11
Et	4-Br	G11
Et	4, 6-Me ₂	G11
Pr	H	G11
Pr	4-Me	G11
Pr	6-Me	G11
Pr	4-Et	G11
Pr	4-OMe	G11
Pr	4-F	G11

Pr	4-Cl	G11
Pr	4, 6-Me ₂	G11
i-Pr	H	G11
F	H	G11
F	4-Me	G11
F	6-Me	G11
F	4-Et	G11
F	4-OMe	G11
F	4-F	G11
F	4-Cl	G11
F	4, 6-Me ₂	G11
Cl	H	G11
Cl	3-Me	G11
Cl	4-Me	G11
Cl	5-Me	G11
Cl	6-Me	G11
Cl	4-Et	G11
Cl	4-t-Bu	G11
Cl	4-i-Pr	G11
Cl	4-OMe	G11
Cl	6-OMe	G11
Cl	3-F	G11
Cl	4-F	G11
Cl	5-F	G11
Cl	6-F	G11
Cl	4-Cl	G11
Cl	6-Cl	G11
Cl	4-Br	G11
Cl	4, 6-Me ₂	G11
Br	H	G11
Br	3-Me	G11
Br	4-Me	G11
Br	5-Me	G11
Br	6-Me	G11
Br	4-Et	G11
Br	4-t-Bu	G11
Br	4-i-Pr	G11
Br	4-OMe	G11
Br	6-OMe	G11
Br	3-F	G11
Br	4-F	G11
Br	5-F	G11
Br	6-F	G11
Br	4-Cl	G11
Br	6-Cl	G11
Br	4-Br	G11
Br	4, 6-Me ₂	G11
OMe	H	G11
SMe	H	G11
SMe	4-Me	G11
SMe	6-Me	G11
SMe	4-Et	G11
SMe	4-OMe	G11
SMe	4-F	G11
SMe	4-Cl	G11
SMe	4, 6-Me ₂	G11
CF ₃	H	G11
CN	H	G11

H	H	G12
H	3-Me	G12
H	4-Me	G12
H	5-Me	G12
H	6-Me	G12
H	4-Et	G12
H	4-t-Bu	G12
H	4-i-Pr	G12
H	4-CF ₃	G12
H	4-OMe	G12
H	6-OMe	G12
H	4-OEt	G12
H	4-SMe	G12
H	4-NMe ₂	G12
H	3-F	G12
H	4-F	G12
H	5-F	G12
H	6-F	G12
H	4-Cl	G12
H	6-Cl	G12
H	4-Br	G12
H	4-I	G12
H	4-CN	G12
H	4, 5-Me ₂	G12
H	4, 6-Me ₂	G12
H	4, 5-(OMe) ₂	G12
Me	H	G12
Me	3-Me	G12
Me	4-Me	G12
Me	5-Me	G12
Me	6-Me	G12
Me	3-Et	G12
Me	4-Et	G12
Me	5-Et	G12
Me	6-Et	G12
Me	4-t-Bu	G12
Me	4-i-Pr	G12
Me	3-CF ₃	G12
Me	4-CF ₃	G12
Me	5-CF ₃	G12
Me	6-CF ₃	G12
Me	3-OMe	G12
Me	4-OMe	G12
Me	5-OMe	G12
Me	6-OMe	G12
Me	3-OEt	G12
Me	4-OEt	G12
Me	5-OEt	G12
Me	6-OEt	G12
Me	3-SMe	G12
Me	4-SMe	G12
Me	5-SMe	G12
Me	6-SMe	G12
Me	3-NMe ₂	G12
Me	4-NMe ₂	G12
Me	5-NMe ₂	G12
Me	6-NMe ₂	G12
Me	3-F	G12

Me	4-F	G12
Me	5-F	G12
Me	6-F	G12
Me	3-Cl	G12
Me	4-Cl	G12
Me	5-Cl	G12
Me	6-Cl	G12
Me	3-Br	G12
Me	4-Br	G12
Me	5-Br	G12
Me	6-Br	G12
Me	3-I	G12
Me	4-I	G12
Me	5-I	G12
Me	6-I	G12
Me	3-CN	G12
Me	4-CN	G12
Me	5-CN	G12
Me	6-CN	G12
Me	4, 5-Me ₂	G12
Me	4, 6-Me ₂	G12
Me	5, 6-Me ₂	G12
Me	4, 5-Cl ₂	G12
Me	4, 6-Cl ₂	G12
Me	5, 6-Cl ₂	G12
Me	4, 5-(OMe) ₂	G12
Me	4, 6-(OMe) ₂	G12
Me	5, 6-(OMe) ₂	G12
Me	3, 4-F ₂	G12
Me	3, 5-F ₂	G12
Me	3, 6-F ₂	G12
Me	4, 5-F ₂	G12
Me	4, 6-F ₂	G12
Me	5, 6-F ₂	G12
Me	4-Me-5-OMe	G12
Me	4-Me-6-OMe	G12
Me	4-Me-3-F	G12
Me	4-Me-5-F	G12
Me	4-Me-6-F	G12
Me	4-Me-5-Cl	G12
Me	4-Me-6-Cl	G12
Me	4-Me-6-Br	G12
Me	4-Me-6-Et	G12
Me	6-Me-4-OMe	G12
Me	6-Me-5-OMe	G12
Me	6-Me-3-F	G12
Me	6-Me-4-F	G12
Me	6-Me-5-F	G12
Me	6-Me-4-Cl	G12
Me	6-Me-5-Cl	G12
Me	6-Me-4-Br	G12
Me	6-Me-4-Et	G12
Me	4-OMe-3-F	G12
Me	4-OMe-5-F	G12
Me	4-OMe-6-F	G12
Me	4-OMe-5-Cl	G12
Me	4-OMe-6-Cl	G12
Me	4-OMe-6-Br	G12

Me	4-OMe-6-Et	G12
Me	4-F-5-Cl	G12
Me	4-F-6-Cl	G12
Me	4-F-6-Br	G12
Me	4-F-6-Et	G12
Me	4-Cl-6-Br	G12
Me	4-Cl-6-Et	G12
Me	4-Br-6-Et	G12
Bt	H	G12
Bt	3-Me	G12
Bt	4-Me	G12
Bt	5-Me	G12
Bt	6-Me	G12
Bt	4-Et	G12
Bt	4-t-Bu	G12
Bt	4-i-Pr	G12
Bt	4-OMe	G12
Bt	6-OMe	G12
Bt	3-F	G12
Bt	4-F	G12
Bt	5-F	G12
Bt	6-F	G12
Bt	4-Cl	G12
Bt	6-Cl	G12
Bt	4-Br	G12
Bt	4, 6-Me ₂	G12
Pr	H	G12
Pr	4-Me	G12
Pr	6-Me	G12
Pr	4-Et	G12
Pr	4-OMe	G12
Pr	4-F	G12
Pr	4-Cl	G12
Pr	4, 6-Me ₂	G12
i-Pr	H	G12
F	H	G12
F	4-Me	G12
F	6-Me	G12
F	4-Et	G12
F	4-OMe	G12
F	4-F	G12
F	4-Cl	G12
F	4, 6-Me ₂	G12
Cl	H	G12
Cl	3-Me	G12
Cl	4-Me	G12
Cl	5-Me	G12
Cl	6-Me	G12
Cl	4-Et	G12
Cl	4-t-Bu	G12
Cl	4-i-Pr	G12
Cl	4-OMe	G12
Cl	6-OMe	G12
Cl	3-F	G12
Cl	4-F	G12
Cl	5-F	G12
Cl	6-F	G12
Cl	4-Cl	G12

Cl	6-Cl	G12
Cl	4-Br	G12
Cl	4, 6-Me ₂	G12
Br	H	G12
Br	3-Me	G12
Br	4-Me	G12
Br	5-Me	G12
Br	6-Me	G12
Br	4-Et	G12
Br	4-t-Bu	G12
Br	4-i-Pr	G12
Br	4-OMe	G12
Br	6-OMe	G12
Br	3-F	G12
Br	4-F	G12
Br	5-F	G12
Br	6-F	G12
Br	4-Cl	G12
Br	6-Cl	G12
Br	4-Br	G12
Br	4, 6-Me ₂	G12
OMe	H	G12
SMe	H	G12
SMe	4-Me	G12
SMe	6-Me	G12
SMe	4-Et	G12
SMe	4-OMe	G12
SMe	4-F	G12
SMe	4-Cl	G12
SMe	4, 6-Me ₂	G12
CF ₃	H	G12
CN	H	G12
H	H	G13
H	3-Me	G13
H	4-Me	G13
H	5-Me	G13
H	6-Me	G13
H	4-Et	G13
H	4-t-Bu	G13
H	4-i-Pr	G13
H	4-CF ₃	G13
H	4-OMe	G13
H	6-OMe	G13
H	4-OEt	G13
H	4-SMe	G13
H	4-NMe ₂	G13
H	3-F	G13
H	4-F	G13
H	5-F	G13
H	6-F	G13
H	4-Cl	G13
H	6-Cl	G13
H	4-Br	G13
H	4-I	G13
H	4-CN	G13
H	4, 5-Me ₂	G13
H	4, 6-Me ₂	G13
H	4, 5-(OMe) ₂	G13

Me	H	G13
Me	3-Me	G13
Me	4-Me	G13
Me	5-Me	G13
Me	6-Me	G13
Me	3-Et	G13
Me	4-Et	G13
Me	5-Et	G13
Me	6-Et	G13
Me	4-t-Bu	G13
Me	4-i-Pr	G13
Me	3-CF ₃	G13
Me	4-CF ₃	G13
Me	5-CF ₃	G13
Me	6-CF ₃	G13
Me	3-OMe	G13
Me	4-OMe	G13
Me	5-OMe	G13
Me	6-OMe	G13
Me	3-OEt	G13
Me	4-OEt	G13
Me	5-OEt	G13
Me	6-OEt	G13
Me	3-SMe	G13
Me	4-SMe	G13
Me	5-SMe	G13
Me	6-SMe	G13
Me	3-NMe ₂	G13
Me	4-NMe ₂	G13
Me	5-NMe ₂	G13
Me	6-NMe ₂	G13
Me	3-F	G13
Me	4-F	G13
Me	5-F	G13
Me	6-F	G13
Me	3-Cl	G13
Me	4-Cl	G13
Me	5-Cl	G13
Me	6-Cl	G13
Me	3-Br	G13
Me	4-Br	G13
Me	5-Br	G13
Me	6-Br	G13
Me	3-I	G13
Me	4-I	G13
Me	5-I	G13
Me	6-I	G13
Me	3-CN	G13
Me	4-CN	G13
Me	5-CN	G13
Me	6-CN	G13
Me	4, 5-Me ₂	G13
Me	4, 6-Me ₂	G13
Me	5, 6-Me ₂	G13
Me	4, 5-Cl ₂	G13
Me	4, 6-Cl ₂	G13
Me	5, 6-Cl ₂	G13
Me	4, 5-(OMe) ₂	G13

Me	4, 6-(OMe) ₂	G13
Me	5, 6-(OMe) ₂	G13
Me	3, 4-F ₂	G13
Me	3, 5-F ₂	G13
Me	3, 6-F ₂	G13
Me	4, 5-F ₂	G13
Me	4, 6-F ₂	G13
Me	5, 6-F ₂	G13
Me	4-Me-5-OMe	G13
Me	4-Me-6-OMe	G13
Me	4-Me-3-F	G13
Me	4-Me-5-F	G13
Me	4-Me-6-F	G13
Me	4-Me-5-Cl	G13
Me	4-Me-6-Cl	G13
Me	4-Me-6-Br	G13
Me	4-Me-6-Et	G13
Me	6-Me-4-OMe	G13
Me	6-Me-5-OMe	G13
Me	6-Me-3-F	G13
Me	6-Me-4-F	G13
Me	6-Me-5-F	G13
Me	6-Me-4-Cl	G13
Me	6-Me-5-Cl	G13
Me	6-Me-4-Br	G13
Me	6-Me-4-Et	G13
Me	4-OMe-3-F	G13
Me	4-OMe-5-F	G13
Me	4-OMe-6-F	G13
Me	4-OMe-5-Cl	G13
Me	4-OMe-6-Cl	G13
Me	4-OMe-6-Br	G13
Me	4-OMe-6-Et	G13
Me	4-F-5-Cl	G13
Me	4-F-6-Cl	G13
Me	4-F-6-Br	G13
Me	4-F-6-Et	G13
Me	4-Cl-6-Br	G13
Me	4-Cl-6-Et	G13
Me	4-Br-6-Et	G13
Et	H	G13
Et	3-Me	G13
Et	4-Me	G13
Et	5-Me	G13
Et	6-Me	G13
Et	4-Et	G13
Et	4-t-Bu	G13
Et	4-i-Pr	G13
Et	4-OMe	G13
Et	6-OMe	G13
Et	3-F	G13
Et	4-F	G13
Et	5-F	G13
Et	6-F	G13
Et	4-Cl	G13
Et	6-Cl	G13
Et	4-Br	G13
Et	4, 6-Me ₂	G13

Pr	H	G13
Pr	4-Me	G13
Pr	6-Me	G13
Pr	4-Et	G13
Pr	4-OMe	G13
Pr	4-F	G13
Pr	4-Cl	G13
Pr	4, 6-Me ₂	G13
i-Pr	H	G13
F	H	G13
F	4-Me	G13
F	6-Me	G13
F	4-Et	G13
F	4-OMe	G13
F	4-F	G13
F	4-Cl	G13
F	4, 6-Me ₂	G13
Cl	H	G13
Cl	3-Me	G13
Cl	4-Me	G13
Cl	5-Me	G13
Cl	6-Me	G13
Cl	4-Et	G13
Cl	4-t-Bu	G13
Cl	4-i-Pr	G13
Cl	4-OMe	G13
Cl	6-OMe	G13
Cl	3-F	G13
Cl	4-F	G13
Cl	5-F	G13
Cl	6-F	G13
Cl	4-Cl	G13
Cl	6-Cl	G13
Cl	4-Br	G13
Cl	4, 6-Me ₂	G13
Br	H	G13
Br	3-Me	G13
Br	4-Me	G13
Br	5-Me	G13
Br	6-Me	G13
Br	4-Et	G13
Br	4-t-Bu	G13
Br	4-i-Pr	G13
Br	4-OMe	G13
Br	6-OMe	G13
Br	3-F	G13
Br	4-F	G13
Br	5-F	G13
Br	6-F	G13
Br	4-Cl	G13
Br	6-Cl	G13
Br	4-Br	G13
Br	4, 6-Me ₂	G13
OMe	H	G13
SMe	H	G13
SMe	4-Me	G13
SMe	6-Me	G13
SMe	4-Et	G13

SMe	4-OMe	G13
SMe	4-F	G13
SMe	4-Cl	G13
SMe	4, 6-Me ₂	G13
CF ₃	H	G13
CN	H	G13
H	H	G14
H	3-Me	G14
H	4-Me	G14
H	5-Me	G14
H	6-Me	G14
H	4-Et	G14
H	4-t-Bu	G14
H	4-i-Pr	G14
H	4-CF ₃	G14
H	4-OMe	G14
H	6-OMe	G14
H	4-OEt	G14
H	4-SMe	G14
H	4-NMe ₂	G14
H	3-F	G14
H	4-F	G14
H	5-F	G14
H	6-F	G14
H	4-Cl	G14
H	6-Cl	G14
H	4-Br	G14
H	4-I	G14
H	4-CN	G14
H	4, 5-Me ₂	G14
H	4, 6-Me ₂	G14
H	4, 5-(OMe) ₂	G14
Me	H	G14
Me	3-Me	G14
Me	4-Me	G14
Me	5-Me	G14
Me	6-Me	G14
Me	3-Et	G14
Me	4-Et	G14
Me	5-Et	G14
Me	6-Et	G14
Me	4-t-Bu	G14
Me	4-i-Pr	G14
Me	3-CF ₃	G14
Me	4-CF ₃	G14
Me	5-CF ₃	G14
Me	6-CF ₃	G14
Me	3-OMe	G14
Me	4-OMe	G14
Me	5-OMe	G14
Me	6-OMe	G14
Me	3-OEt	G14
Me	4-OEt	G14
Me	5-OEt	G14
Me	6-OEt	G14
Me	3-SMe	G14
Me	4-SMe	G14
Me	5-SMe	G14

Me	6-SMe	G14
Me	3-NMe ₂	G14
Me	4-NMe ₂	G14
Me	5-NMe ₂	G14
Me	6-NMe ₂	G14
Me	3-F	G14
Me	4-F	G14
Me	5-F	G14
Me	6-F	G14
Me	3-Cl	G14
Me	4-Cl	G14
Me	5-Cl	G14
Me	6-Cl	G14
Me	3-Br	G14
Me	4-Br	G14
Me	5-Br	G14
Me	6-Br	G14
Me	3-I	G14
Me	4-I	G14
Me	5-I	G14
Me	6-I	G14
Me	3-CN	G14
Me	4-CN	G14
Me	5-CN	G14
Me	6-CN	G14
Me	4, 5-Me ₂	G14
Me	4, 6-Me ₂	G14
Me	5, 6-Me ₂	G14
Me	4, 5-Cl ₂	G14
Me	4, 6-Cl ₂	G14
Me	5, 6-Cl ₂	G14
Me	4, 5-(OMe) ₂	G14
Me	4, 6-(OMe) ₂	G14
Me	5, 6-(OMe) ₂	G14
Me	3, 4-F ₂	G14
Me	3, 5-F ₂	G14
Me	3, 6-F ₂	G14
Me	4, 5-F ₂	G14
Me	4, 6-F ₂	G14
Me	5, 6-F ₂	G14
Me	4-Me-5-OMe	G14
Me	4-Me-6-OMe	G14
Me	4-Me-3-F	G14
Me	4-Me-5-F	G14
Me	4-Me-6-F	G14
Me	4-Me-5-Cl	G14
Me	4-Me-6-Cl	G14
Me	4-Me-6-Br	G14
Me	4-Me-6-Et	G14
Me	6-Me-4-OMe	G14
Me	6-Me-5-OMe	G14
Me	6-Me-3-F	G14
Me	6-Me-4-F	G14
Me	6-Me-5-F	G14
Me	6-Me-4-Cl	G14
Me	6-Me-5-Cl	G14
Me	6-Me-4-Br	G14
Me	6-Me-4-Et	G14

Me	4-OMe-3-F	G14
Me	4-OMe-5-F	G14
Me	4-OMe-6-F	G14
Me	4-OMe-5-Cl	G14
Me	4-OMe-6-Cl	G14
Me	4-OMe-6-Br	G14
Me	4-OMe-6-Et	G14
Me	4-F-5-Cl	G14
Me	4-F-6-Cl	G14
Me	4-F-6-Br	G14
Me	4-F-6-Et	G14
Me	4-Cl-6-Br	G14
Me	4-Cl-6-Et	G14
Me	4-Br-6-Et	G14
Et	H	G14
Et	3-Me	G14
Et	4-Me	G14
Et	5-Me	G14
Et	6-Me	G14
Et	4-Et	G14
Et	4-t-Bu	G14
Et	4-i-Pr	G14
Et	4-OMe	G14
Et	6-OMe	G14
Et	3-F	G14
Et	4-F	G14
Et	5-F	G14
Et	6-F	G14
Et	4-Cl	G14
Et	6-Cl	G14
Et	4-Br	G14
Et	4, 6-Me ₂	G14
Pr	H	G14
Pr	4-Me	G14
Pr	6-Me	G14
Pr	4-Et	G14
Pr	4-OMe	G14
Pr	4-F	G14
Pr	4-Cl	G14
Pr	4, 6-Me ₂	G14
i-Pr	H	G14
F	H	G14
F	4-Me	G14
F	6-Me	G14
F	4-Et	G14
F	4-OMe	G14
F	4-F	G14
F	4-Cl	G14
F	4, 6-Me ₂	G14
Cl	H	G14
Cl	3-Me	G14
Cl	4-Me	G14
Cl	5-Me	G14
Cl	6-Me	G14
Cl	4-Et	G14
Cl	4-t-Bu	G14
Cl	4-i-Pr	G14
Cl	4-OMe	G14

C1	6-OMe	G14
C1	3-F	G14
C1	4-F	G14
C1	5-F	G14
C1	6-F	G14
C1	4-Cl	G14
C1	6-Cl	G14
C1	4-Br	G14
C1	4, 6-Me ₂	G14
Br	H	G14
Br	3-Me	G14
Br	4-Me	G14
Br	5-Me	G14
Br	6-Me	G14
Br	4-Et	G14
Br	4-t-Bu	G14
Br	4-i-Pr	G14
Br	4-OMe	G14
Br	6-OMe	G14
Br	3-F	G14
Br	4-F	G14
Br	5-F	G14
Br	6-F	G14
Br	4-Cl	G14
Br	6-Cl	G14
Br	4-Br	G14
Br	4, 6-Me ₂	G14
OMe	H	G14
SMe	H	G14
SMe	4-Me	G14
SMe	6-Me	G14
SMe	4-Et	G14
SMe	4-OMe	G14
SMe	4-F	G14
SMe	4-Cl	G14
SMe	4, 6-Me ₂	G14
CF ₃	H	G14
CN	H	G14
H	H	G15
H	3-Me	G15
H	4-Me	G15
H	5-Me	G15
H	6-Me	G15
H	4-Et	G15
H	4-t-Bu	G15
H	4-i-Pr	G15
H	4-CF ₃	G15
H	4-OMe	G15
H	6-OMe	G15
H	4-OEt	G15
H	4-SMe	G15
H	4-NMe ₂	G15
H	3-F	G15
H	4-F	G15
H	5-F	G15
H	6-F	G15
H	4-Cl	G15
H	6-Cl	G15

H	4-Br	G15
H	4-I	G15
H	4-CN	G15
H	4, 5-Me ₂	G15
H	4, 6-Me ₂	G15
H	4, 5-(OMe) ₂	G15
Me	H	G15
Me	3-Me	G15
Me	4-Me	G15
Me	5-Me	G15
Me	6-Me	G15
Me	3-Et	G15
Me	4-Et	G15
Me	5-Et	G15
Me	6-Et	G15
Me	4-t-Bu	G15
Me	4-i-Pr	G15
Me	3-CF ₃	G15
Me	4-CF ₃	G15
Me	5-CF ₃	G15
Me	6-CF ₃	G15
Me	3-OMe	G15
Me	4-OMe	G15
Me	5-OMe	G15
Me	6-OMe	G15
Me	3-OEt	G15
Me	4-OEt	G15
Me	5-OEt	G15
Me	6-OEt	G15
Me	3-SMe	G15
Me	4-SMe	G15
Me	5-SMe	G15
Me	6-SMe	G15
Me	3-NMe ₂	G15
Me	4-NMe ₂	G15
Me	5-NMe ₂	G15
Me	6-NMe ₂	G15
Me	3-F	G15
Me	4-F	G15
Me	5-F	G15
Me	6-F	G15
Me	3-Cl	G15
Me	4-Cl	G15
Me	5-Cl	G15
Me	6-Cl	G15
Me	3-Br	G15
Me	4-Br	G15
Me	5-Br	G15
Me	6-Br	G15
Me	3-I	G15
Me	4-I	G15
Me	5-I	G15
Me	6-I	G15
Me	3-CN	G15
Me	4-CN	G15
Me	5-CN	G15
Me	6-CN	G15
Me	4, 5-Me ₂	G15

Me	4, 6-Me ₂	G15
Me	5, 6-Me ₂	G15
Me	4, 5-Cl ₂	G15
Me	4, 6-Cl ₂	G15
Me	5, 6-Cl ₂	G15
Me	4, 5-(OMe) ₂	G15
Me	4, 6-(OMe) ₂	G15
Me	5, 6-(OMe) ₂	G15
Me	3, 4-F ₂	G15
Me	3, 5-F ₂	G15
Me	3, 6-F ₂	G15
Me	4, 5-F ₂	G15
Me	4, 6-F ₂	G15
Me	5, 6-F ₂	G15
Me	4-Me-5-OMe	G15
Me	4-Me-6-OMe	G15
Me	4-Me-3-F	G15
Me	4-Me-5-F	G15
Me	4-Me-6-F	G15
Me	4-Me-5-Cl	G15
Me	4-Me-6-Cl	G15
Me	4-Me-6-Br	G15
Me	4-Me-6-Et	G15
Me	6-Me-4-OMe	G15
Me	6-Me-5-OMe	G15
Me	6-Me-3-F	G15
Me	6-Me-4-F	G15
Me	6-Me-5-F	G15
Me	6-Me-4-Cl	G15
Me	6-Me-5-Cl	G15
Me	6-Me-4-Br	G15
Me	6-Me-4-Et	G15
Me	4-OMe-3-F	G15
Me	4-OMe-5-F	G15
Me	4-OMe-6-F	G15
Me	4-OMe-5-Cl	G15
Me	4-OMe-6-Cl	G15
Me	4-OMe-6-Br	G15
Me	4-OMe-6-Et	G15
Me	4-F-5-Cl	G15
Me	4-F-6-Cl	G15
Me	4-F-6-Br	G15
Me	4-F-6-Et	G15
Me	4-Cl-6-Br	G15
Me	4-Cl-6-Et	G15
Me	4-Br-6-Et	G15
Et	H	G15
Et	3-Me	G15
Et	4-Me	G15
Et	5-Me	G15
Et	6-Me	G15
Et	4-Et	G15
Et	4-t-Bu	G15
Et	4-i-Pr	G15
Et	4-OMe	G15
Et	6-OMe	G15
Et	3-F	G15
Et	4-F	G15

Et	5-F	G15
Et	6-F	G15
Et	4-Cl	G15
Et	6-Cl	G15
Et	4-Br	G15
Et	4, 6-Me ₂	G15
Pr	H	G15
Pr	4-Me	G15
Pr	6-Me	G15
Pr	4-Et	G15
Pr	4-OMe	G15
Pr	4-F	G15
Pr	4-Cl	G15
Pr	4, 6-Me ₂	G15
i-Pr	H	G15
F	H	G15
F	4-Me	G15
F	6-Me	G15
F	4-Et	G15
F	4-OMe	G15
F	4-F	G15
F	4-Cl	G15
F	4, 6-Me ₂	G15
Cl	H	G15
Cl	3-Me	G15
Cl	4-Me	G15
Cl	5-Me	G15
Cl	6-Me	G15
Cl	4-Et	G15
Cl	4-t-Bu	G15
Cl	4-i-Pr	G15
Cl	4-OMe	G15
Cl	6-OMe	G15
Cl	3-F	G15
Cl	4-F	G15
Cl	5-F	G15
Cl	6-F	G15
Cl	4-Cl	G15
Cl	6-Cl	G15
Cl	4-Br	G15
Cl	4, 6-Me ₂	G15
Br	H	G15
Br	3-Me	G15
Br	4-Me	G15
Br	5-Me	G15
Br	6-Me	G15
Br	4-Et	G15
Br	4-t-Bu	G15
Br	4-i-Pr	G15
Br	4-OMe	G15
Br	6-OMe	G15
Br	3-F	G15
Br	4-F	G15
Br	5-F	G15
Br	6-F	G15
Br	4-Cl	G15
Br	6-Cl	G15
Br	4-Br	G15

Br	4, 6-Me ₂	G15
OMe	H	G15
SMe	H	G15
SMe	4-Me	G15
SMe	6-Me	G15
SMe	4-Et	G15
SMe	4-OMe	G15
SMe	4-F	G15
SMe	4-Cl	G15
SMe	4, 6-Me ₂	G15
CF ₃	H	G15
CN	H	G15
H	H	G16
H	3-Me	G16
H	4-Me	G16
H	5-Me	G16
H	6-Me	G16
H	4-Et	G16
H	4-t-Bu	G16
H	4-i-Pr	G16
H	4-CF ₃	G16
H	4-OMe	G16
H	6-OMe	G16
H	4-OEt	G16
H	4-SMe	G16
H	4-NMe ₂	G16
H	3-F	G16
H	4-F	G16
H	5-F	G16
H	6-F	G16
H	4-Cl	G16
H	6-Cl	G16
H	4-Br	G16
H	4-I	G16
H	4-CN	G16
H	4, 5-Me ₂	G16
H	4, 6-Me ₂	G16
H	4, 5-(OMe) ₂	G16
Me	H	G16
Me	3-Me	G16
Me	4-Me	G16
Me	5-Me	G16
Me	6-Me	G16
Me	3-Et	G16
Me	4-Et	G16
Me	5-Et	G16
Me	6-Et	G16
Me	4-t-Bu	G16
Me	4-i-Pr	G16
Me	3-CF ₃	G16
Me	4-CF ₃	G16
Me	5-CF ₃	G16
Me	6-CF ₃	G16
Me	3-OMe	G16
Me	4-OMe	G16
Me	5-OMe	G16
Me	6-OMe	G16
Me	3-OEt	G16

Me	4-OEt	G16
Me	5-OEt	G16
Me	6-OEt	G16
Me	3-SMe	G16
Me	4-SMe	G16
Me	5-SMe	G16
Me	6-SMe	G16
Me	3-NMe ₂	G16
Me	4-NMe ₂	G16
Me	5-NMe ₂	G16
Me	6-NMe ₂	G16
Me	3-F	G16
Me	4-F	G16
Me	5-F	G16
Me	6-F	G16
Me	3-Cl	G16
Me	4-Cl	G16
Me	5-Cl	G16
Me	6-Cl	G16
Me	3-Br	G16
Me	4-Br	G16
Me	5-Br	G16
Me	6-Br	G16
Me	3-I	G16
Me	4-I	G16
Me	5-I	G16
Me	6-I	G16
Me	3-CN	G16
Me	4-CN	G16
Me	5-CN	G16
Me	6-CN	G16
Me	4, 5-Me ₂	G16
Me	4, 6-Me ₂	G16
Me	5, 6-Me ₂	G16
Me	4, 5-Cl ₂	G16
Me	4, 6-Cl ₂	G16
Me	5, 6-Cl ₂	G16
Me	4, 5-(OMe) ₂	G16
Me	4, 6-(OMe) ₂	G16
Me	5, 6-(OMe) ₂	G16
Me	3, 4-F ₂	G16
Me	3, 5-F ₂	G16
Me	3, 6-F ₂	G16
Me	4, 5-F ₂	G16
Me	4, 6-F ₂	G16
Me	5, 6-F ₂	G16
Me	4-Me-5-OMe	G16
Me	4-Me-6-OMe	G16
Me	4-Me-3-F	G16
Me	4-Me-5-F	G16
Me	4-Me-6-F	G16
Me	4-Me-5-Cl	G16
Me	4-Me-6-Cl	G16
Me	4-Me-6-Br	G16
Me	4-Me-6-Et	G16
Me	6-Me-4-OMe	G16
Me	6-Me-5-OMe	G16
Me	6-Me-3-F	G16

Me	6-Me-4-F	G16
Me	6-Me-5-F	G16
Me	6-Me-4-Cl	G16
Me	6-Me-5-Cl	G16
Me	6-Me-4-Br	G16
Me	6-Me-4-Et	G16
Me	4-OMe-3-F	G16
Me	4-OMe-5-F	G16
Me	4-OMe-6-F	G16
Me	4-OMe-5-Cl	G16
Me	4-OMe-6-Cl	G16
Me	4-OMe-6-Br	G16
Me	4-OMe-6-Et	G16
Me	4-F-5-Cl	G16
Me	4-F-6-Cl	G16
Me	4-F-6-Br	G16
Me	4-F-6-Et	G16
Me	4-Cl-6-Br	G16
Me	4-Cl-6-Et	G16
Me	4-Br-6-Et	G16
Et	H	G16
Et	3-Me	G16
Et	4-Me	G16
Et	5-Me	G16
Et	6-Me	G16
Et	4-Et	G16
Et	4-t-Bu	G16
Et	4-i-Pr	G16
Et	4-OMe	G16
Et	6-OMe	G16
Et	3-F	G16
Et	4-F	G16
Et	5-F	G16
Et	6-F	G16
Et	4-Cl	G16
Et	6-Cl	G16
Et	4-Br	G16
Et	4, 6-Me ₂	G16
Pr	H	G16
Pr	4-Me	G16
Pr	6-Me	G16
Pr	4-Et	G16
Pr	4-OMe	G16
Pr	4-F	G16
Pr	4-Cl	G16
Pr	4, 6-Me ₂	G16
i-Pr	H	G16
F	H	G16
F	4-Me	G16
F	6-Me	G16
F	4-Et	G16
F	4-OMe	G16
F	4-F	G16
F	4-Cl	G16
F	4, 6-Me ₂	G16
Cl	H	G16
Cl	3-Me	G16
Cl	4-Me	G16

C1	5-Me	G16
C1	6-Me	G16
C1	4-Et	G16
C1	4-t-Bu	G16
C1	4-i-Pr	G16
C1	4-OMe	G16
C1	6-OMe	G16
C1	3-F	G16
C1	4-F	G16
C1	5-F	G16
C1	6-F	G16
C1	4-Cl	G16
C1	6-Cl	G16
C1	4-Br	G16
C1	4,6-Me ₂	G16
Br	H	G16
Br	3-Me	G16
Br	4-Me	G16
Br	5-Me	G16
Br	6-Me	G16
Br	4-Et	G16
Br	4-t-Bu	G16
Br	4-i-Pr	G16
Br	4-OMe	G16
Br	6-OMe	G16
Br	3-F	G16
Br	4-F	G16
Br	5-F	G16
Br	6-F	G16
Br	4-Cl	G16
Br	6-Cl	G16
Br	4-Br	G16
Br	4,6-Me ₂	G16
OMe	H	G16
SMe	H	G16
SMe	4-Me	G16
SMe	6-Me	G16
SMe	4-Et	G16
SMe	4-OMe	G16
SMe	4-F	G16
SMe	4-Cl	G16
SMe	4,6-Me ₂	G16
CF ₃	H	G16
CN	H	G16
H	H	G17
H	3-Me	G17
H	4-Me	G17
H	5-Me	G17
H	6-Me	G17
H	4-Et	G17
H	4-t-Bu	G17
H	4-i-Pr	G17
H	4-CF ₃	G17
H	4-OMe	G17
H	6-OMe	G17
H	4-OEt	G17
H	4-SMe	G17
H	4-NMe ₂	G17

H	3-F	G17
H	4-F	G17
H	5-F	G17
H	6-F	G17
H	4-Cl	G17
H	6-Cl	G17
H	4-Br	G17
H	4-I	G17
H	4-CN	G17
H	4, 5-Me ₂	G17
H	4, 6-Me ₂	G17
H	4, 5-(OMe) ₂	G17
Me	H	G17
Me	3-Me	G17
Me	4-Me	G17
Me	5-Me	G17
Me	6-Me	G17
Me	3-Et	G17
Me	4-Et	G17
Me	5-Et	G17
Me	6-Et	G17
Me	4-i-Bu	G17
Me	4-i-Pr	G17
Me	3-CF ₃	G17
Me	4-CF ₃	G17
Me	5-CF ₃	G17
Me	6-CF ₃	G17
Me	3-OMe	G17
Me	4-OMe	G17
Me	5-OMe	G17
Me	6-OMe	G17
Me	3-OEt	G17
Me	4-OEt	G17
Me	5-OEt	G17
Me	6-OEt	G17
Me	3-SMe	G17
Me	4-SMe	G17
Me	5-SMe	G17
Me	6-SMe	G17
Me	3-NMe ₂	G17
Me	4-NMe ₂	G17
Me	5-NMe ₂	G17
Me	6-NMe ₂	G17
Me	3-F	G17
Me	4-F	G17
Me	5-F	G17
Me	6-F	G17
Me	3-Cl	G17
Me	4-Cl	G17
Me	5-Cl	G17
Me	6-Cl	G17
Me	3-Br	G17
Me	4-Br	G17
Me	5-Br	G17
Me	6-Br	G17
Me	3-I	G17
Me	4-I	G17
Me	5-I	G17

Me	6-I	G17
Me	3-CN	G17
Me	4-CN	G17
Me	5-CN	G17
Me	6-CN	G17
Me	4, 5-Me ₂	G17
Me	4, 6-Me ₂	G17
Me	5, 6-Me ₂	G17
Me	4, 5-Cl ₂	G17
Me	4, 6-Cl ₂	G17
Me	5, 6-Cl ₂	G17
Me	4, 5-(OMe) ₂	G17
Me	4, 6-(OMe) ₂	G17
Me	5, 6-(OMe) ₂	G17
Me	3, 4-F ₂	G17
Me	3, 5-F ₂	G17
Me	3, 6-F ₂	G17
Me	4, 5-F ₂	G17
Me	4, 6-F ₂	G17
Me	5, 6-F ₂	G17
Me	4-Me-5-OMe	G17
Me	4-Me-6-OMe	G17
Me	4-Me-3-F	G17
Me	4-Me-5-F	G17
Me	4-Me-6-F	G17
Me	4-Me-5-Cl	G17
Me	4-Me-6-Cl	G17
Me	4-Me-6-Br	G17
Me	4-Me-6-Et	G17
Me	6-Me-4-OMe	G17
Me	6-Me-5-OMe	G17
Me	6-Me-3-F	G17
Me	6-Me-4-F	G17
Me	6-Me-5-F	G17
Me	6-Me-4-Cl	G17
Me	6-Me-5-Cl	G17
Me	6-Me-4-Br	G17
Me	6-Me-4-Et	G17
Me	4-OMe-3-F	G17
Me	4-OMe-5-F	G17
Me	4-OMe-6-F	G17
Me	4-OMe-5-Cl	G17
Me	4-OMe-6-Cl	G17
Me	4-OMe-6-Br	G17
Me	4-OMe-6-Et	G17
Me	4-F-5-Cl	G17
Me	4-F-6-Cl	G17
Me	4-F-6-Br	G17
Me	4-F-6-Et	G17
Me	4-Cl-6-Br	G17
Me	4-Cl-6-Et	G17
Me	4-Br-6-Et	G17
Et	H	G17
Et	3-Me	G17
Et	4-Me	G17
Et	5-Me	G17
Et	6-Me	G17
Et	4-Et	G17

Et	4-t-Bu	G17
Et	4-i-Pr	G17
Et	4-OMe	G17
Et	6-OMe	G17
Et	3-F	G17
Et	4-F	G17
Et	5-F	G17
Et	6-F	G17
Et	4-Cl	G17
Et	6-Cl	G17
Et	4-Br	G17
Et	4, 6-Me ₂	G17
Pr	H	G17
Pr	4-Me	G17
Pr	6-Me	G17
Pr	4-Et	G17
Pr	4-OMe	G17
Pr	4-F	G17
Pr	4-Cl	G17
Pr	4, 6-Me ₂	G17
i-Pr	H	G17
F	H	G17
F	4-Me	G17
F	6-Me	G17
F	4-Et	G17
F	4-OMe	G17
F	4-F	G17
F	4-Cl	G17
F	4, 6-Me ₂	G17
Cl	H	G17
Cl	3-Me	G17
Cl	4-Me	G17
Cl	5-Me	G17
Cl	6-Me	G17
Cl	4-Et	G17
Cl	4-t-Bu	G17
Cl	4-i-Pr	G17
Cl	4-OMe	G17
Cl	6-OMe	G17
Cl	3-F	G17
Cl	4-F	G17
Cl	5-F	G17
Cl	6-F	G17
Cl	4-Cl	G17
Cl	6-Cl	G17
Cl	4-Br	G17
Cl	4, 6-Me ₂	G17
Br	H	G17
Br	3-Me	G17
Br	4-Me	G17
Br	5-Me	G17
Br	6-Me	G17
Br	4-Et	G17
Br	4-t-Bu	G17
Br	4-i-Pr	G17
Br	4-OMe	G17
Br	6-OMe	G17
Br	3-F	G17

Br	4-F	G17
Br	5-F	G17
Br	6-F	G17
Br	4-Cl	G17
Br	6-Cl	G17
Br	4-Br	G17
Br	4, 6-Me ₂	G17
OMe	H	G17
SMe	H	G17
SMe	4-Me	G17
SMe	6-Me	G17
SMe	4-Et	G17
SMe	4-OMe	G17
SMe	4-F	G17
SMe	4-Cl	G17
SMe	4, 6-Me ₂	G17
CF ₃	H	G17
CN	H	G17
H	H	G18
H	3-Me	G18
H	4-Me	G18
H	5-Me	G18
H	6-Me	G18
H	4-Et	G18
H	4-t-Bu	G18
H	4-i-Pr	G18
H	4-CF ₃	G18
H	4-OMe	G18
H	6-OMe	G18
H	4-OEt	G18
H	4-SMe	G18
H	4-NMe ₂	G18
H	3-F	G18
H	4-F	G18
H	5-F	G18
H	6-F	G18
H	4-Cl	G18
H	6-Cl	G18
H	4-Br	G18
H	4-I	G18
H	4-CN	G18
H	4, 5-Me ₂	G18
H	4, 6-Me ₂	G18
H	4, 5-(OMe) ₂	G18
Me	H	G18
Me	3-Me	G18
Me	4-Me	G18
Me	5-Me	G18
Me	6-Me	G18
Me	3-Et	G18
Me	4-Et	G18
Me	5-Et	G18
Me	6-Et	G18
Me	4-i-Bu	G18
Me	4-i-Pr	G18
Me	3-CF ₃	G18
Me	4-CF ₃	G18
Me	5-CF ₃	G18

Me	6-CF ₃	G18
Me	3-OMe	G18
Me	4-OMe	G18
Me	5-OMe	G18
Me	6-OMe	G18
Me	3-OEt	G18
Me	4-OEt	G18
Me	5-OEt	G18
Me	6-OEt	G18
Me	3-SMe	G18
Me	4-SMe	G18
Me	5-SMe	G18
Me	6-SMe	G18
Me	3-NMe ₂	G18
Me	4-NMe ₂	G18
Me	5-NMe ₂	G18
Me	6-NMe ₂	G18
Me	3-F	G18
Me	4-F	G18
Me	5-F	G18
Me	6-F	G18
Me	3-Cl	G18
Me	4-Cl	G18
Me	5-Cl	G18
Me	6-Cl	G18
Me	3-Br	G18
Me	4-Br	G18
Me	5-Br	G18
Me	6-Br	G18
Me	3-I	G18
Me	4-I	G18
Me	5-I	G18
Me	6-I	G18
Me	3-CN	G18
Me	4-CN	G18
Me	5-CN	G18
Me	6-CN	G18
Me	4, 5-Me ₂	G18
Me	4, 6-Me ₂	G18
Me	5, 6-Me ₂	G18
Me	4, 5-Cl ₂	G18
Me	4, 6-Cl ₂	G18
Me	5, 6-Cl ₂	G18
Me	4, 5-(OMe) ₂	G18
Me	4, 6-(OMe) ₂	G18
Me	5, 6-(OMe) ₂	G18
Me	3, 4-F ₂	G18
Me	3, 5-F ₂	G18
Me	3, 6-F ₂	G18
Me	4, 5-F ₂	G18
Me	4, 6-F ₂	G18
Me	5, 6-F ₂	G18
Me	4-Me-5-OMe	G18
Me	4-Me-6-OMe	G18
Me	4-Me-3-F	G18
Me	4-Me-5-F	G18
Me	4-Me-6-F	G18
Me	4-Me-5-Cl	G18

Me	4-Me-6-Cl	G18
Me	4-Me-6-Br	G18
Me	4-Me-6-Et	G18
Me	6-Me-4-OMe	G18
Me	6-Me-5-OMe	G18
Me	6-Me-3-F	G18
Me	6-Me-4-F	G18
Me	6-Me-5-F	G18
Me	6-Me-4-Cl	G18
Me	6-Me-5-Cl	G18
Me	6-Me-4-Br	G18
Me	6-Me-4-Et	G18
Me	4-OMe-3-F	G18
Me	4-OMe-5-F	G18
Me	4-OMe-6-F	G18
Me	4-OMe-5-Cl	G18
Me	4-OMe-6-Cl	G18
Me	4-OMe-6-Br	G18
Me	4-OMe-6-Et	G18
Me	4-F-5-Cl	G18
Me	4-F-6-Cl	G18
Me	4-F-6-Br	G18
Me	4-F-6-Et	G18
Me	4-Cl-6-Br	G18
Me	4-Cl-6-Et	G18
Me	4-Br-6-Et	G18
Et	H	G18
Et	3-Me	G18
Et	4-Me	G18
Et	5-Me	G18
Et	6-Me	G18
Et	4-Et	G18
Et	4-t-Bu	G18
Et	4-i-Pr	G18
Et	4-OMe	G18
Et	6-OMe	G18
Et	3-F	G18
Et	4-F	G18
Et	5-F	G18
Et	6-F	G18
Et	4-Cl	G18
Et	6-Cl	G18
Et	4-Br	G18
Et	4, 6-Me ₂	G18
Pr	H	G18
Pr	4-Me	G18
Pr	6-Me	G18
Pr	4-Et	G18
Pr	4-OMe	G18
Pr	4-F	G18
Pr	4-Cl	G18
Pr	4, 6-Me ₂	G18
j-Pr	H	G18
F	H	G18
F	4-Me	G18
F	6-Me	G18
F	4-Et	G18
F	4-OMe	G18

F	4-F	G18
F	4-Cl	G18
F	4, 6-Me ₂	G18
Cl	H	G18
Cl	3-Me	G18
Cl	4-Me	G18
Cl	5-Me	G18
Cl	6-Me	G18
Cl	4-Et	G18
Cl	4-t-Bu	G18
Cl	4-i-Pr	G18
Cl	4-OMe	G18
Cl	6-OMe	G18
Cl	3-F	G18
Cl	4-F	G18
Cl	5-F	G18
Cl	6-F	G18
Cl	4-Cl	G18
Cl	6-Cl	G18
Cl	4-Br	G18
Cl	4, 6-Me ₂	G18
Br	H	G18
Br	3-Me	G18
Br	4-Me	G18
Br	5-Me	G18
Br	6-Me	G18
Br	4-Et	G18
Br	4-t-Bu	G18
Br	4-i-Pr	G18
Br	4-OMe	G18
Br	6-OMe	G18
Br	3-F	G18
Br	4-F	G18
Br	5-F	G18
Br	6-F	G18
Br	4-Cl	G18
Br	6-Cl	G18
Br	4-Br	G18
Br	4, 6-Me ₂	G18
OMe	H	G18
SMe	H	G18
SMe	4-Me	G18
SMe	6-Me	G18
SMe	4-Et	G18
SMe	4-OMe	G18
SMe	4-F	G18
SMe	4-Cl	G18
SMe	4, 6-Me ₂	G18
CF ₃	H	G18
CN	H	G18
H	H	G19
H	4-Me	G19
H	6-Me	G19
H	4-Et	G19
H	4-OMe	G19
H	4-F	G19
H	4-Cl	G19
H	4, 6-Me ₂	G19

Me	H	G19
Me	4-Me	G19
Me	6-Me	G19
Me	4-Et	G19
Me	4-OMe	G19
Me	4-F	G19
Me	4-Cl	G19
Me	4, 6-Me ₂	G19
Et	H	G19
Et	4-Me	G19
Et	6-Me	G19
Et	4-Et	G19
Et	4-OMe	G19
Et	4-F	G19
Et	4-Cl	G19
Et	4, 6-Me ₂	G19
H	H	G20
H	4-Me	G20
H	6-Me	G20
H	4-Et	G20
H	4-OMe	G20
H	4-F	G20
H	4-Cl	G20
H	4, 6-Me ₂	G20
Me	H	G20
Me	4-Me	G20
Me	6-Me	G20
Me	4-Et	G20
Me	4-OMe	G20
Me	4-F	G20
Me	4-Cl	G20
Me	4, 6-Me ₂	G20
Et	H	G20
Et	4-Me	G20
Et	6-Me	G20
Et	4-Et	G20
Et	4-OMe	G20
Et	4-F	G20
Et	4-Cl	G20
Et	4, 6-Me ₂	G20
H	H	G21
H	4-Me	G21
H	6-Me	G21
H	4-Et	G21
H	4-OMe	G21
H	4-F	G21
H	4-Cl	G21
H	4, 6-Me ₂	G21
Me	H	G21
Me	4-Me	G21
Me	6-Me	G21
Me	4-Et	G21
Me	4-OMe	G21
Me	4-F	G21
Me	4-Cl	G21
Me	4, 6-Me ₂	G21
Et	H	G21
Et	4-Me	G21

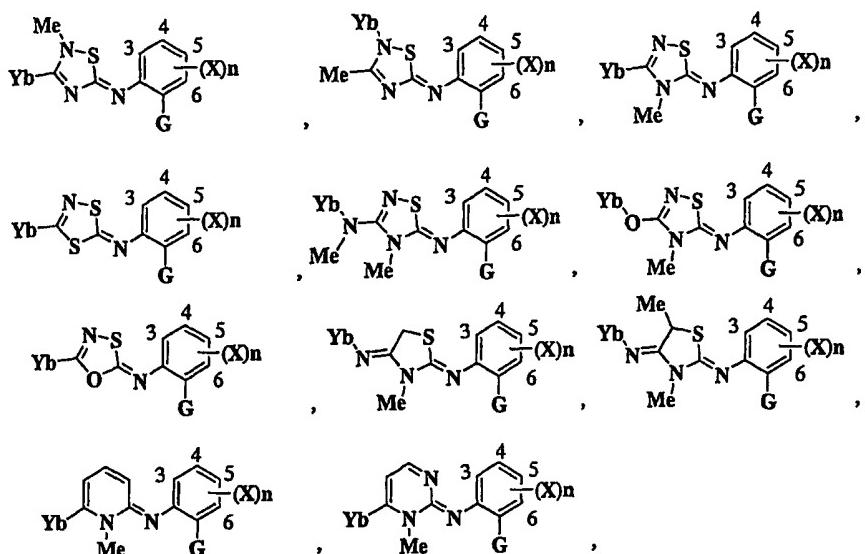
Et	6-Me	G21
Et	4-Et	G21
Et	4-OMe	G21
Et	4-F	G21
Et	4-Cl	G21
Et	4, 6-Me ₂	G21
H	H	G22
H	4-Me	G22
H	6-Me	G22
H	4-Et	G22
H	4-OMe	G22
H	4-F	G22
H	4-Cl	G22
H	4, 6-Me ₂	G22
Me	H	G22
Me	4-Me	G22
Me	6-Me	G22
Me	4-Et	G22
Me	4-OMe	G22
Me	4-F	G22
Me	4-Cl	G22
Me	4, 6-Me ₂	G22
Et	H	G22
Et	4-Me	G22
Et	6-Me	G22
Et	4-Et	G22
Et	4-OMe	G22
Et	4-F	G22
Et	4-Cl	G22
Et	4, 6-Me ₂	G22
H	H	G23
H	4-Me	G23
H	6-Me	G23
H	4-Et	G23
H	4-OMe	G23
H	4-F	G23
H	4-Cl	G23
H	4, 6-Me ₂	G23
Me	H	G23
Me	4-Me	G23
Me	6-Me	G23
Me	4-Et	G23
Me	4-OMe	G23
Me	4-F	G23
Me	4-Cl	G23
Me	4, 6-Me ₂	G23
Et	H	G23
Et	4-Me	G23
Et	6-Me	G23
Et	4-Et	G23
Et	4-OMe	G23
Et	4-F	G23
Et	4-Cl	G23
Et	4, 6-Me ₂	G23
H	H	G24
H	4-Me	G24
H	6-Me	G24
H	4-Et	G24

H	4-OMe	G24
H	4-F	G24
H	4-Cl	G24
H	4, 6-Me ₂	G24
Me	H	G24
Me	4-Me	G24
Me	6-Me	G24
Me	4-Et	G24
Me	4-OMe	G24
Me	4-F	G24
Me	4-Cl	G24
Me	4, 6-Me ₂	G24
Et	H	G24
Et	4-Me	G24
Et	6-Me	G24
Et	4-Et	G24
Et	4-OMe	G24
Et	4-F	G24
Et	4-Cl	G24
Et	4, 6-Me ₂	G24
H	H	G25
H	4-Me	G25
H	6-Me	G25
H	4-Et	G25
H	4-OMe	G25
H	4-F	G25
H	4-Cl	G25
H	4, 6-Me ₂	G25
Me	H	G25
Me	4-Me	G25
Me	6-Me	G25
Me	4-Et	G25
Me	4-OMe	G25
Me	4-F	G25
Me	4-Cl	G25
Me	4, 6-Me ₂	G25
Et	H	G25
Et	4-Me	G25
Et	6-Me	G25
Et	4-Et	G25
Et	4-OMe	G25
Et	4-F	G25
Et	4-Cl	G25
Et	4, 6-Me ₂	G25
H	H	G26
H	4-Me	G26
H	6-Me	G26
H	4-Et	G26
H	4-OMe	G26
H	4-F	G26
H	4-Cl	G26
H	4, 6-Me ₂	G26
Me	H	G26
Me	4-Me	G26
Me	6-Me	G26
Me	4-Et	G26
Me	4-OMe	G26
Me	4-F	G26

Me	4-Cl	G26
Me	4, 6-Me ₂	G26
Et	H	G26
Et	4-Me	G26
Et	6-Me	G26
Et	4-Et	G26
Et	4-OMe	G26
Et	4-F	G26
Et	4-Cl	G26
Et	4, 6-Me ₂	G26
H	H	G27
H	4-Me	G27
H	6-Me	G27
H	4-Et	G27
H	4-OMe	G27
H	4-F	G27
H	4-Cl	G27
H	4, 6-Me ₂	G27
Me	H	G27
Me	4-Me	G27
Me	6-Me	G27
Me	4-Et	G27
Me	4-OMe	G27
Me	4-F	G27
Me	4-Cl	G27
Me	4, 6-Me ₂	G27
Et	H	G27
Et	4-Me	G27
Et	6-Me	G27
Et	4-Et	G27
Et	4-OMe	G27
Et	4-F	G27
Et	4-Cl	G27
Et	4, 6-Me ₂	G27
H	H	G28
H	4-Me	G28
H	6-Me	G28
H	4-Et	G28
H	4-OMe	G28
H	4-F	G28
H	4-Cl	G28
H	4, 6-Me ₂	G28
Me	H	G28
Me	4-Me	G28
Me	6-Me	G28
Me	4-Et	G28
Me	4-OMe	G28
Me	4-F	G28
Me	4-Cl	G28
Me	4, 6-Me ₂	G28
Et	H	G28
Et	4-Me	G28
Et	6-Me	G28
Et	4-Et	G28
Et	4-OMe	G28
Et	4-F	G28
Et	4-Cl	G28
Et	4, 6-Me ₂	G28

H	H	G29
H	4-Me	G29
H	6-Me	G29
H	4-Et	G29
H	4-OMe	G29
H	4-F	G29
H	4-Cl	G29
H	4, 6-Me ₂	G29
Me	H	G29
Me	4-Me	G29
Me	6-Me	G29
Me	4-Et	G29
Me	4-OMe	G29
Me	4-F	G29
Me	4-Cl	G29
Me	4, 6-Me ₂	G29
Bt	H	G29
Bt	4-Me	G29
Bt	6-Me	G29
Bt	4-Et	G29
Bt	4-OMe	G29
Bt	4-F	G29
Bt	4-Cl	G29
Bt	4, 6-Me ₂	G29
H	H	G30
H	4-Me	G30
H	6-Me	G30
H	4-Et	G30
H	4-OMe	G30
H	4-F	G30
H	4-Cl	G30
H	4, 6-Me ₂	G30
Me	H	G30
Me	4-Me	G30
Me	6-Me	G30
Me	4-Et	G30
Me	4-OMe	G30
Me	4-F	G30
Me	4-Cl	G30
Me	4, 6-Me ₂	G30
Bt	H	G30
Bt	4-Me	G30
Bt	6-Me	G30
Bt	4-Et	G30
Bt	4-OMe	G30
Bt	4-F	G30
Bt	4-Cl	G30
Bt	4, 6-Me ₂	G30

〔第2表〕



Y b	X n	G
4-CF ₃ -Ph	H	G1
4-Me-Ph	H	G1
4-Cl-Ph	H	G1
4-t-Bu-Ph	H	G1
4-F-Ph	H	G1
3-Me-Ph	H	G1
3-Cl-Ph	H	G1
3-CF ₃ O-Ph	H	G1
3-Br-Ph	H	G1
2-Cl-Ph	H	G1
2-F-Ph	H	G1
2, 4-Cl ₂ -Ph	H	G1
2, 4-F ₂ -Ph	H	G1
2, 6-F ₂ -Ph	H	G1
3, 4-F ₂ -Ph	H	G1
4-F-3-CF ₃ -Ph	H	G1
3-F-4-CF ₃ -Ph	H	G1
2-F-5-CF ₃ -Ph	H	G1
2-F-4-CF ₃ -Ph	H	G1
5-Cl-2-pyridyl	H	G1
5-CF ₃ -2-pyridyl	H	G1
5-CF ₃ -2-thienyl	H	G1
4-CF ₃ -2-thienyl	H	G1
5-CF ₃ -3-isoxazolyl	H	G1
1-Me-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	H	G1
1-Et-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	H	G1
1-Pr-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	H	G1
1-(F ₂ HC-)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	H	G1
1-(F ₂ HCCH ₂ -)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	H	G1
1-Me-5-t-Bu-3-pyrazolyl	H	G1
1-Me-4-pyrazolyl	H	G1
1-Et-4-pyrazolyl	H	G1

1-Pr-4-pyrazolyl	H	G1
1-(2-pyridyl)-4-pyrazolyl	H	G1
4-CF ₃ -Ph	4-Me	G1
4-Me-Ph	4-Me	G1
4-Cl-Ph	4-Me	G1
4-t-Bu-Ph	4-Me	G1
4-F-Ph	4-Me	G1
3-Me-Ph	4-Me	G1
3-Cl-Ph	4-Me	G1
3-CF ₃ O-Ph	4-Me	G1
3-Br-Ph	4-Me	G1
2-Cl-Ph	4-Me	G1
2-F-Ph	4-Me	G1
2, 4-Cl ₂ -Ph	4-Me	G1
2, 4-F ₂ -Ph	4-Me	G1
2, 6-F ₂ -Ph	4-Me	G1
3, 4-F ₂ -Ph	4-Me	G1
4-F-3-CF ₃ -Ph	4-Me	G1
3-F-4-CF ₃ -Ph	4-Me	G1
2-F-5-CF ₃ -Ph	4-Me	G1
2-F-4-CF ₃ -Ph	4-Me	G1
5-Cl-2-pyridyl	4-Me	G1
5-CF ₃ -2-pyridyl	4-Me	G1
5-CF ₃ -2-thienyl	4-Me	G1
4-CF ₃ -2-thienyl	4-Me	G1
5-CF ₃ -3-isoxazolyl	4-Me	G1
1-Me-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	4-Me	G1
1-Et-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	4-Me	G1
1-Pr-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	4-Me	G1
1-(F ₂ HC-)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	4-Me	G1
1-(F ₂ HCCH ₂ -)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	4-Me	G1
1-Me-5-t-Bu-3-pyrazolyl	4-Me	G1
1-Me-4-pyrazolyl	4-Me	G1
1-Et-4-pyrazolyl	4-Me	G1
1-Pr-4-pyrazolyl	4-Me	G1
1-(2-pyridyl)-4-pyrazolyl	4-Me	G1
4-CF ₃ -Ph	6-Me	G1
4-Me-Ph	6-Me	G1
4-Cl-Ph	6-Me	G1
4-t-Bu-Ph	6-Me	G1
4-F-Ph	6-Me	G1
3-Me-Ph	6-Me	G1
3-Cl-Ph	6-Me	G1
3-CF ₃ O-Ph	6-Me	G1
3-Br-Ph	6-Me	G1
2-Cl-Ph	6-Me	G1
2-F-Ph	6-Me	G1
2, 4-Cl ₂ -Ph	6-Me	G1
2, 4-F ₂ -Ph	6-Me	G1
2, 6-F ₂ -Ph	6-Me	G1
3, 4-F ₂ -Ph	6-Me	G1
4-F-3-CF ₃ -Ph	6-Me	G1
3-F-4-CF ₃ -Ph	6-Me	G1
2-F-5-CF ₃ -Ph	6-Me	G1
2-F-4-CF ₃ -Ph	6-Me	G1
5-Cl-2-pyridyl	6-Me	G1
5-CF ₃ -2-pyridyl	6-Me	G1
5-CF ₃ -2-thienyl	6-Me	G1

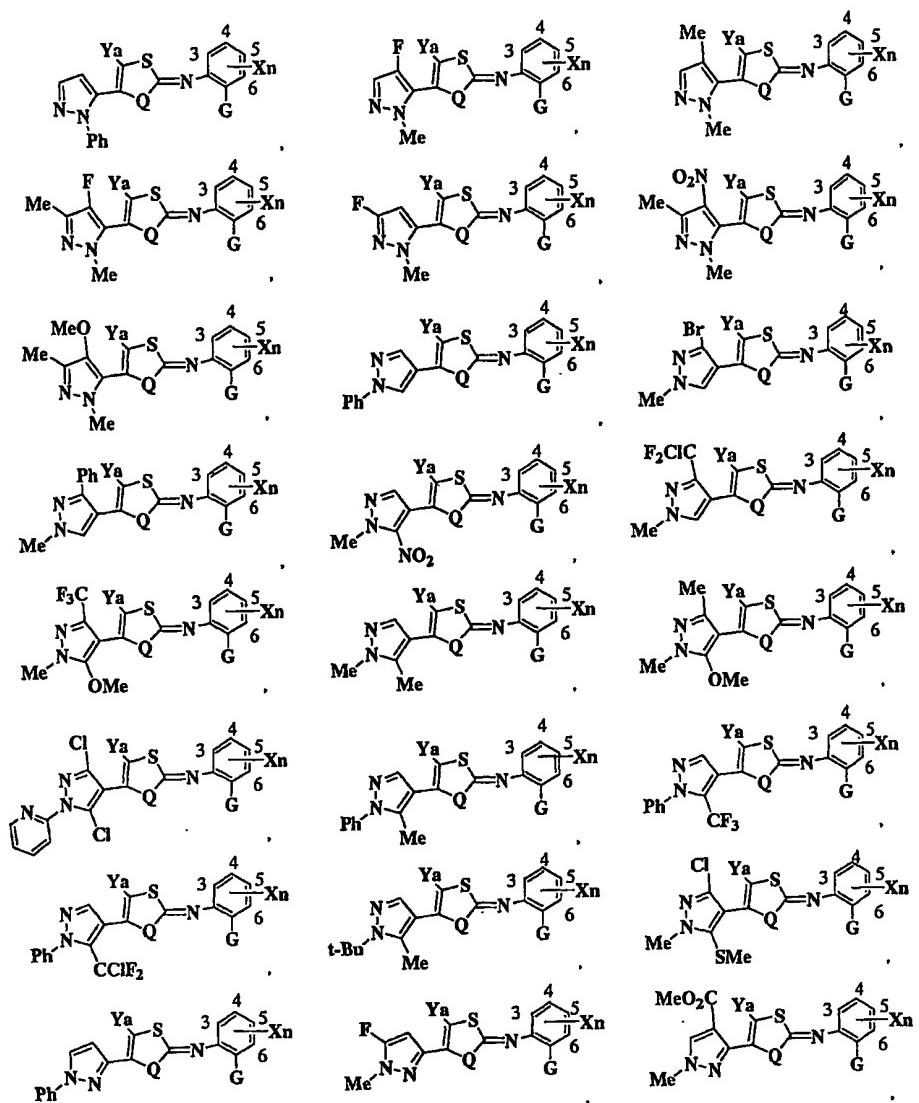
4-CF ₃ -2-thienyl	6-Me	G1
5-CF ₃ -3-isoxazolyl	6-Me	G1
1-Me-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	6-Me	G1
1-Et-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	6-Me	G1
1-Pr-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	6-Me	G1
1-(F ₂ HC)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	6-Me	G1
1-(F ₂ HCCH ₂)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	6-Me	G1
1-Me-5-t-Bu-3-pyrazolyl	6-Me	G1
1-Me-4-pyrazolyl	6-Me	G1
1-Et-4-pyrazolyl	6-Me	G1
1-Pr-4-pyrazolyl	6-Me	G1
1-(2-pyridyl)-4-pyrazolyl	6-Me	G1
4-CF ₃ -Ph	H	G11
4-Me-Ph	H	G11
4-Cl-Ph	H	G11
4-t-Bu-Ph	H	G11
4-F-Ph	H	G11
3-Me-Ph	H	G11
3-Cl-Ph	H	G11
3-CF ₃ O-Ph	H	G11
3-Br-Ph	H	G11
2-Cl-Ph	H	G11
2-F-Ph	H	G11
2,4-Cl ₂ -Ph	H	G11
2,4-F ₂ -Ph	H	G11
2,6-F ₂ -Ph	H	G11
3,4-F ₂ -Ph	H	G11
4-F-3-CF ₃ -Ph	H	G11
3-F-4-CF ₃ -Ph	H	G11
2-F-5-CF ₃ -Ph	H	G11
2-F-4-CF ₃ -Ph	H	G11
5-Cl-2-pyridyl	H	G11
5-CF ₃ -2-pyridyl	H	G11
5-CF ₃ -2-thienyl	H	G11
4-CF ₃ -2-thienyl	H	G11
5-CF ₃ -3-isoxazolyl	H	G11
1-Me-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	H	G11
1-Et-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	H	G11
1-Pr-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	H	G11
1-(F ₂ HC)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	H	G11
1-(F ₂ HCCH ₂)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	H	G11
1-Me-5-t-Bu-3-pyrazolyl	H	G11
1-Me-4-pyrazolyl	H	G11
1-Et-4-pyrazolyl	H	G11
1-Pr-4-pyrazolyl	H	G11
1-(2-pyridyl)-4-pyrazolyl	H	G11
4-CF ₃ -Ph	4-Me	G11
4-Me-Ph	4-Me	G11
4-Cl-Ph	4-Me	G11
4-t-Bu-Ph	4-Me	G11
4-F-Ph	4-Me	G11
3-Me-Ph	4-Me	G11
3-Cl-Ph	4-Me	G11
3-CF ₃ O-Ph	4-Me	G11
3-Br-Ph	4-Me	G11
2-Cl-Ph	4-Me	G11
2-F-Ph	4-Me	G11
2,4-Cl ₂ -Ph	4-Me	G11

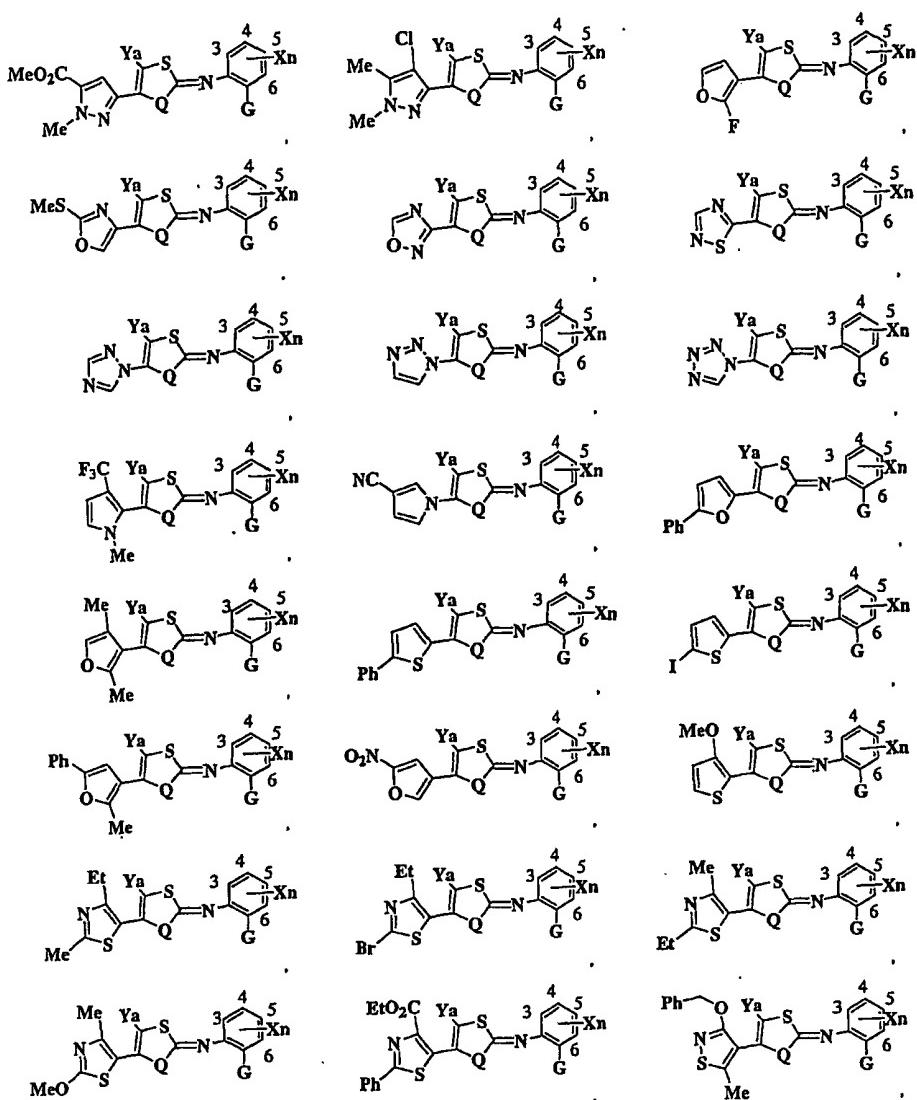
2, 4-F ₂ -Ph	4-Me	G11
2, 6-F ₂ -Ph	4-Me	G11
3, 4-F ₂ -Ph	4-Me	G11
4-F-3-CF ₃ -Ph	4-Me	G11
3-F-4-CF ₃ -Ph	4-Me	G11
2-F-5-CF ₃ -Ph	4-Me	G11
2-F-4-CF ₃ -Ph	4-Me	G11
5-Cl-2-pyridyl	4-Me	G11
5-CF ₃ -2-pyridyl	4-Me	G11
5-CF ₃ -2-thienyl	4-Me	G11
4-CF ₃ -2-thienyl	4-Me	G11
5-CF ₃ -3-isoxazolyl	4-Me	G11
1-Me-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	4-Me	G11
1-Et-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	4-Me	G11
1-Pr-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	4-Me	G11
1-(F ₂ HC-)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	4-Me	G11
1-(F ₂ HCCH ₂ -)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	4-Me	G11
1-Me-5-t-Bu-3-pyrazolyl	4-Me	G11
1-Me-4-pyrazolyl	4-Me	G11
1-Et-4-pyrazolyl	4-Me	G11
1-Pr-4-pyrazolyl	4-Me	G11
1-(2-pyridyl)-4-pyrazolyl	4-Me	G11
4-CF ₃ -Ph	6-Me	G11
4-Me-Ph	6-Me	G11
4-Cl-Ph	6-Me	G11
4-t-Bu-Ph	6-Me	G11
4-F-Ph	6-Me	G11
3-Me-Ph	6-Me	G11
3-Cl-Ph	6-Me	G11
3-CF ₃ O-Ph	6-Me	G11
3-Br-Ph	6-Me	G11
2-Cl-Ph	6-Me	G11
2-F-Ph	6-Me	G11
2, 4-Cl ₂ -Ph	6-Me	G11
2, 4-F ₂ -Ph	6-Me	G11
2, 6-F ₂ -Ph	6-Me	G11
3, 4-F ₂ -Ph	6-Me	G11
4-F-3-CF ₃ -Ph	6-Me	G11
3-F-4-CF ₃ -Ph	6-Me	G11
2-F-5-CF ₃ -Ph	6-Me	G11
2-F-4-CF ₃ -Ph	6-Me	G11
5-Cl-2-pyridyl	6-Me	G11
5-CF ₃ -2-pyridyl	6-Me	G11
5-CF ₃ -2-thienyl	6-Me	G11
4-CF ₃ -2-thienyl	6-Me	G11
5-CF ₃ -3-isoxazolyl	6-Me	G11
1-Me-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	6-Me	G11
1-Et-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	6-Me	G11
1-Pr-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	6-Me	G11
1-(F ₂ HC-)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	6-Me	G11
1-(F ₂ HCCH ₂ -)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	6-Me	G11
1-Me-5-t-Bu-3-pyrazolyl	6-Me	G11
1-Me-4-pyrazolyl	6-Me	G11
1-Et-4-pyrazolyl	6-Me	G11
1-Pr-4-pyrazolyl	6-Me	G11
1-(2-pyridyl)-4-pyrazolyl	6-Me	G11
4-CF ₃ -Ph	H	G13
4-Me-Ph	H	G13

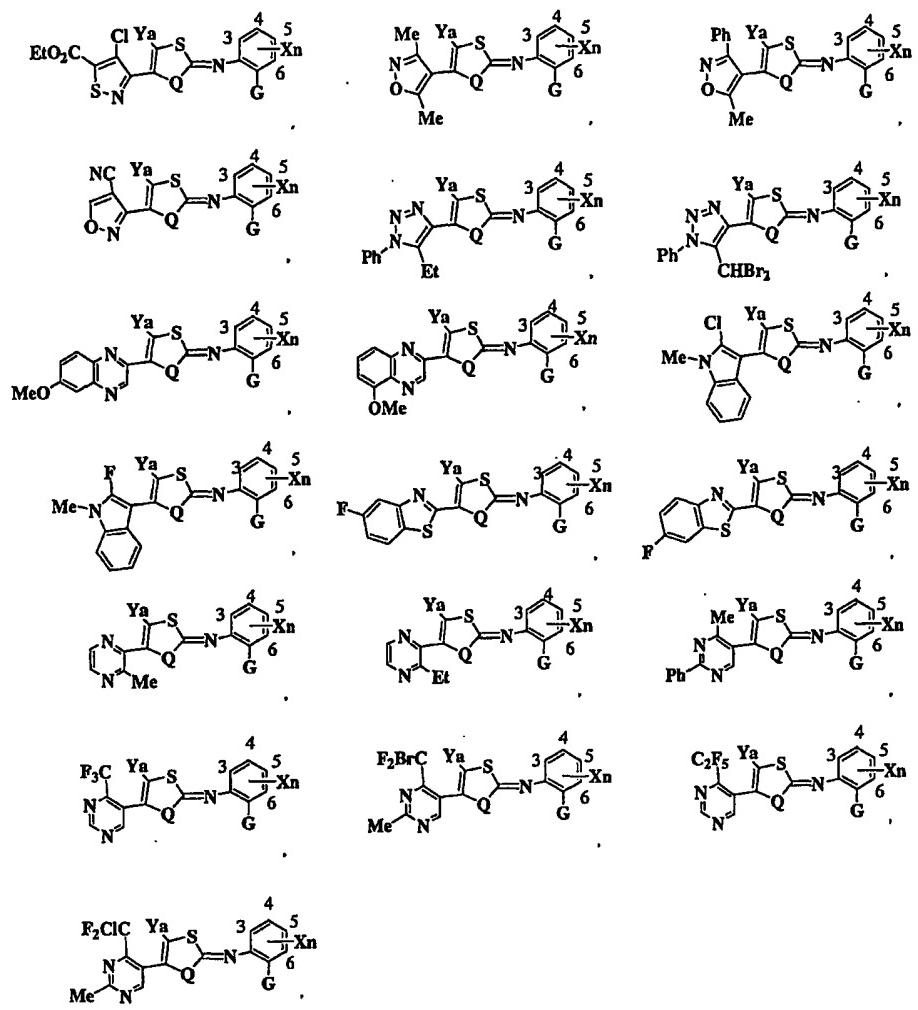
4-Cl-Ph	H	G13
4-t-Bu-Ph	H	G13
4-F-Ph	H	G13
3-Me-Ph	H	G13
3-Cl-Ph	H	G13
3-CF ₃ O-Ph	H	G13
3-Br-Ph	H	G13
2-Cl-Ph	H	G13
2-F-Ph	H	G13
2, 4-Cl ₂ -Ph	H	G13
2, 4-F ₂ -Ph	H	G13
2, 6-F ₂ -Ph	H	G13
3, 4-F ₂ -Ph	H	G13
4-F-3-CF ₃ -Ph	H	G13
3-F-4-CF ₃ -Ph	H	G13
2-F-5-CF ₃ -Ph	H	G13
2-F-4-CF ₃ -Ph	H	G13
5-Cl-2-pyridyl	H	G13
5-CF ₃ -2-pyridyl	H	G13
5-CF ₃ -2-thienyl	H	G13
4-CF ₃ -2-thienyl	H	G13
5-CF ₃ -3-isoxazolyl	H	G13
1-Me-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	H	G13
1-Et-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	H	G13
1-Pr-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	H	G13
1-(F ₂ HC-)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	H	G13
1-(F ₂ HCC ₂ -)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	H	G13
1-Me-5-t-Bu-3-pyrazolyl	H	G13
1-Me-4-pyrazolyl	H	G13
1-Et-4-pyrazolyl	H	G13
1-Pr-4-pyrazolyl	H	G13
1-(2-pyridyl)-4-pyrazolyl	H	G13
4-CF ₃ -Ph	4-Me	G13
4-Me-Ph	4-Me	G13
4-Cl-Ph	4-Me	G13
4-t-Bu-Ph	4-Me	G13
4-F-Ph	4-Me	G13
3-Me-Ph	4-Me	G13
3-Cl-Ph	4-Me	G13
3-CF ₃ O-Ph	4-Me	G13
3-Br-Ph	4-Me	G13
2-Cl-Ph	4-Me	G13
2-F-Ph	4-Me	G13
2, 4-Cl ₂ -Ph	4-Me	G13
2, 4-F ₂ -Ph	4-Me	G13
2, 6-F ₂ -Ph	4-Me	G13
3, 4-F ₂ -Ph	4-Me	G13
4-F-3-CF ₃ -Ph	4-Me	G13
3-F-4-CF ₃ -Ph	4-Me	G13
2-F-5-CF ₃ -Ph	4-Me	G13
2-F-4-CF ₃ -Ph	4-Me	G13
5-Cl-2-pyridyl	4-Me	G13
5-CF ₃ -2-pyridyl	4-Me	G13
5-CF ₃ -2-thienyl	4-Me	G13
4-CF ₃ -2-thienyl	4-Me	G13
5-CF ₃ -3-isoxazolyl	4-Me	G13
1-Me-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	4-Me	G13
1-Et-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	4-Me	G13

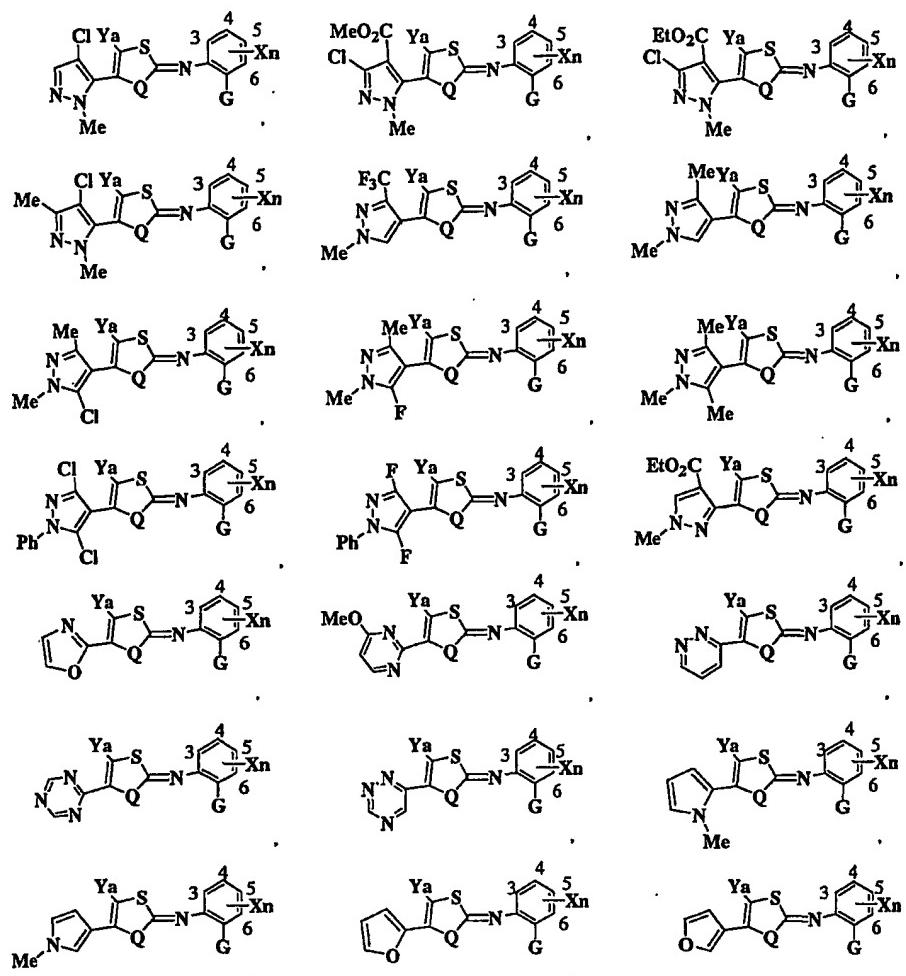
1-Pr-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	4-Me	G13
1-(F ₂ HC-)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	4-Me	G13
1-(F ₂ HCCH ₂ -)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	4-Me	G13
1-Me-5-t-Bu-3-pyrazolyl	4-Me	G13
1-Me-4-pyrazolyl	4-Me	G13
1-Et-4-pyrazolyl	4-Me	G13
1-Pr-4-pyrazolyl	4-Me	G13
1-(2-pyridyl)-4-pyrazolyl	4-Me	G13
4-CF ₃ -Ph	6-Me	G13
4-Me-Ph	6-Me	G13
4-Cl-Ph	6-Me	G13
4-t-Bu-Ph	6-Me	G13
4-F-Ph	6-Me	G13
3-Me-Ph	6-Me	G13
3-Cl-Ph	6-Me	G13
3-CF ₃ O-Ph	6-Me	G13
3-Br-Ph	6-Me	G13
2-Cl-Ph	6-Me	G13
2-F-Ph	6-Me	G13
2,4-Cl ₂ -Ph	6-Me	G13
2,4-F ₂ -Ph	6-Me	G13
2,6-F ₂ -Ph	6-Me	G13
3,4-F ₂ -Ph	6-Me	G13
4-F-3-CF ₃ -Ph	6-Me	G13
3-F-4-CF ₃ -Ph	6-Me	G13
2-F-5-CF ₃ -Ph	6-Me	G13
2-F-4-CF ₃ -Ph	6-Me	G13
5-Cl-2-pyridyl	6-Me	G13
5-CF ₃ -2-pyridyl	6-Me	G13
5-CF ₃ -2-thienyl	6-Me	G13
4-CF ₃ -2-thienyl	6-Me	G13
5-CF ₃ -3-isoxazolyl	6-Me	G13
1-Me-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	6-Me	G13
1-Et-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	6-Me	G13
1-Pr-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	6-Me	G13
1-(F ₂ HC-)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	6-Me	G13
1-(F ₂ HCCH ₂ -)-5-CF ₃ -3-pyrazolyl	6-Me	G13
1-Me-5-t-Bu-3-pyrazolyl	6-Me	G13
1-Me-4-pyrazolyl	6-Me	G13
1-Et-4-pyrazolyl	6-Me	G13
1-Pr-4-pyrazolyl	6-Me	G13
1-(2-pyridyl)-4-pyrazolyl	6-Me	G13

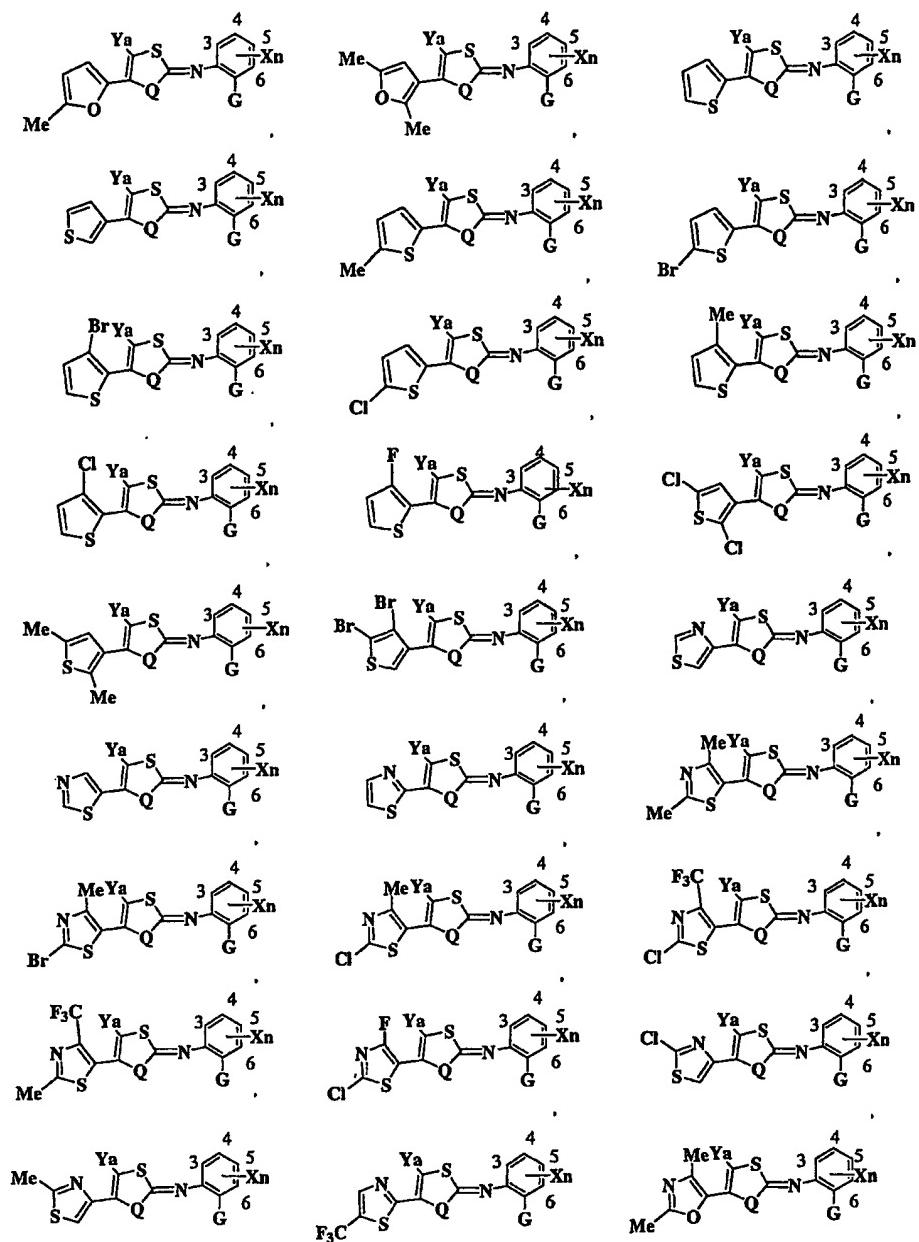
〔第3表〕

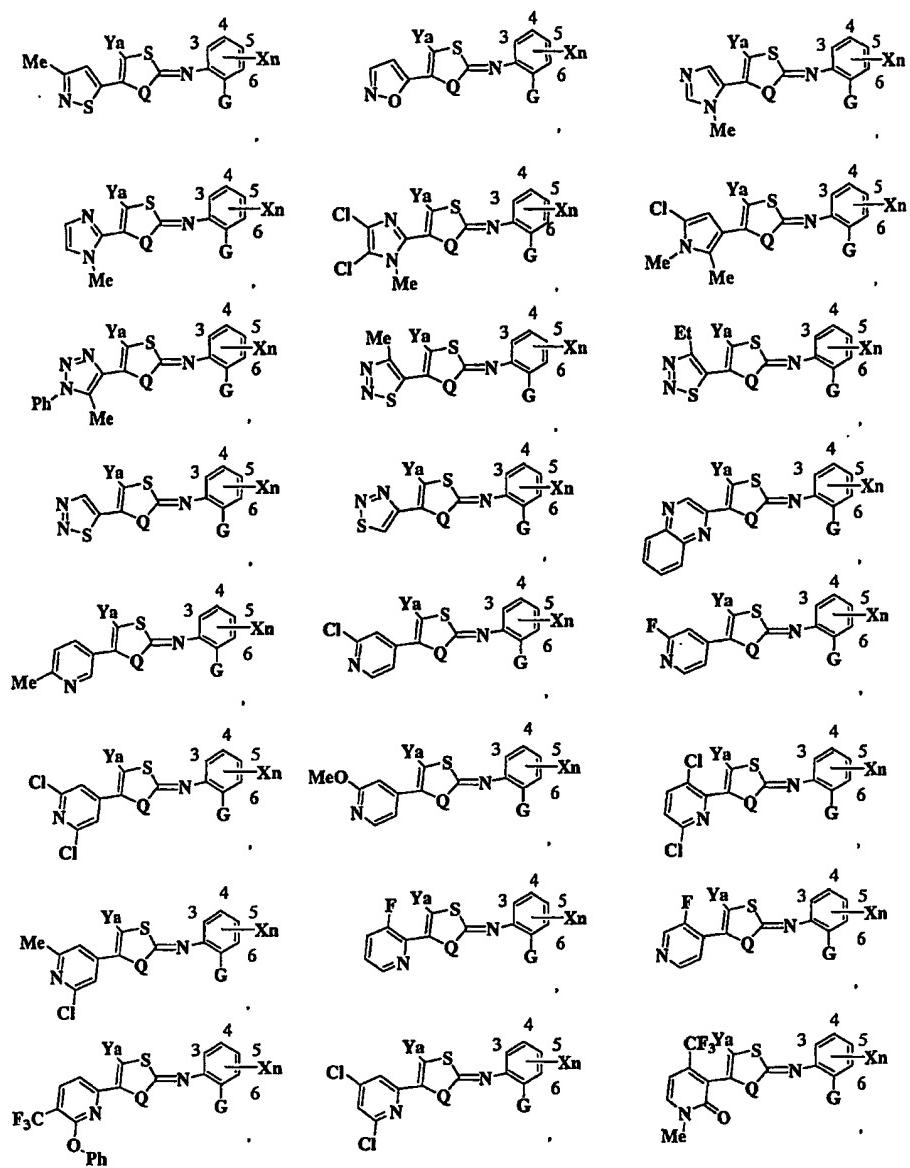


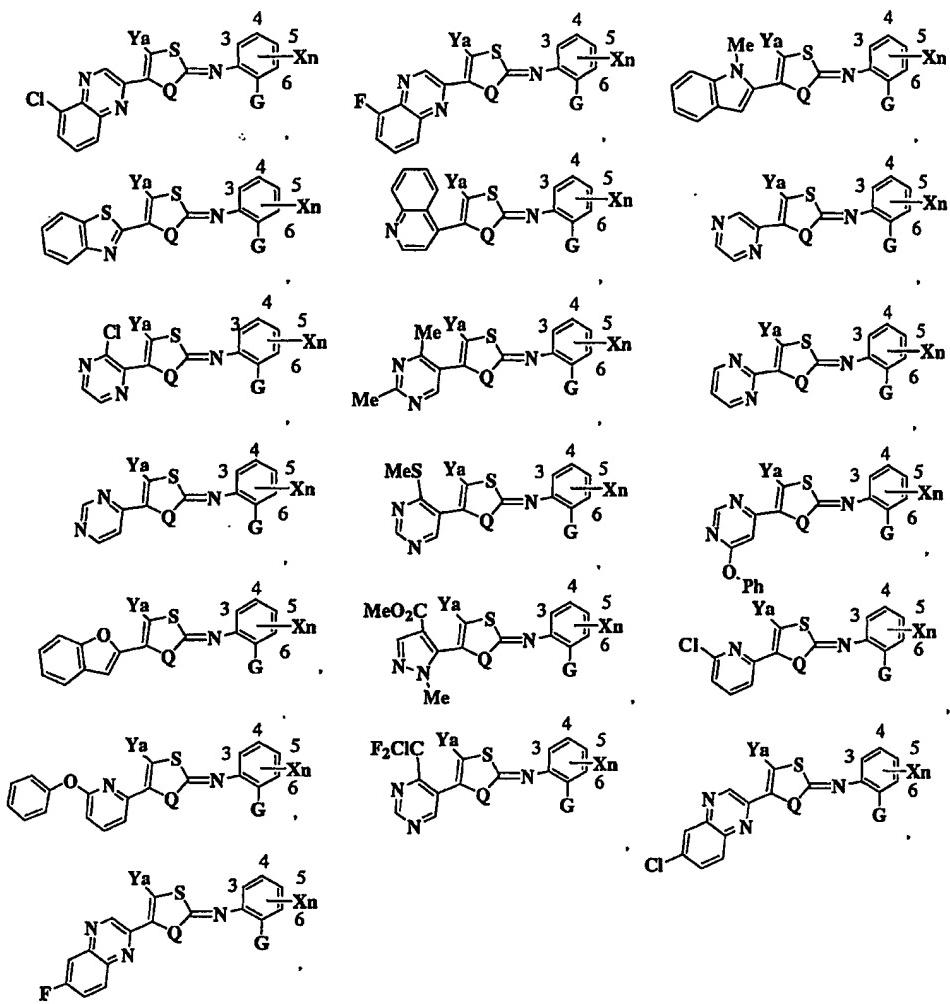


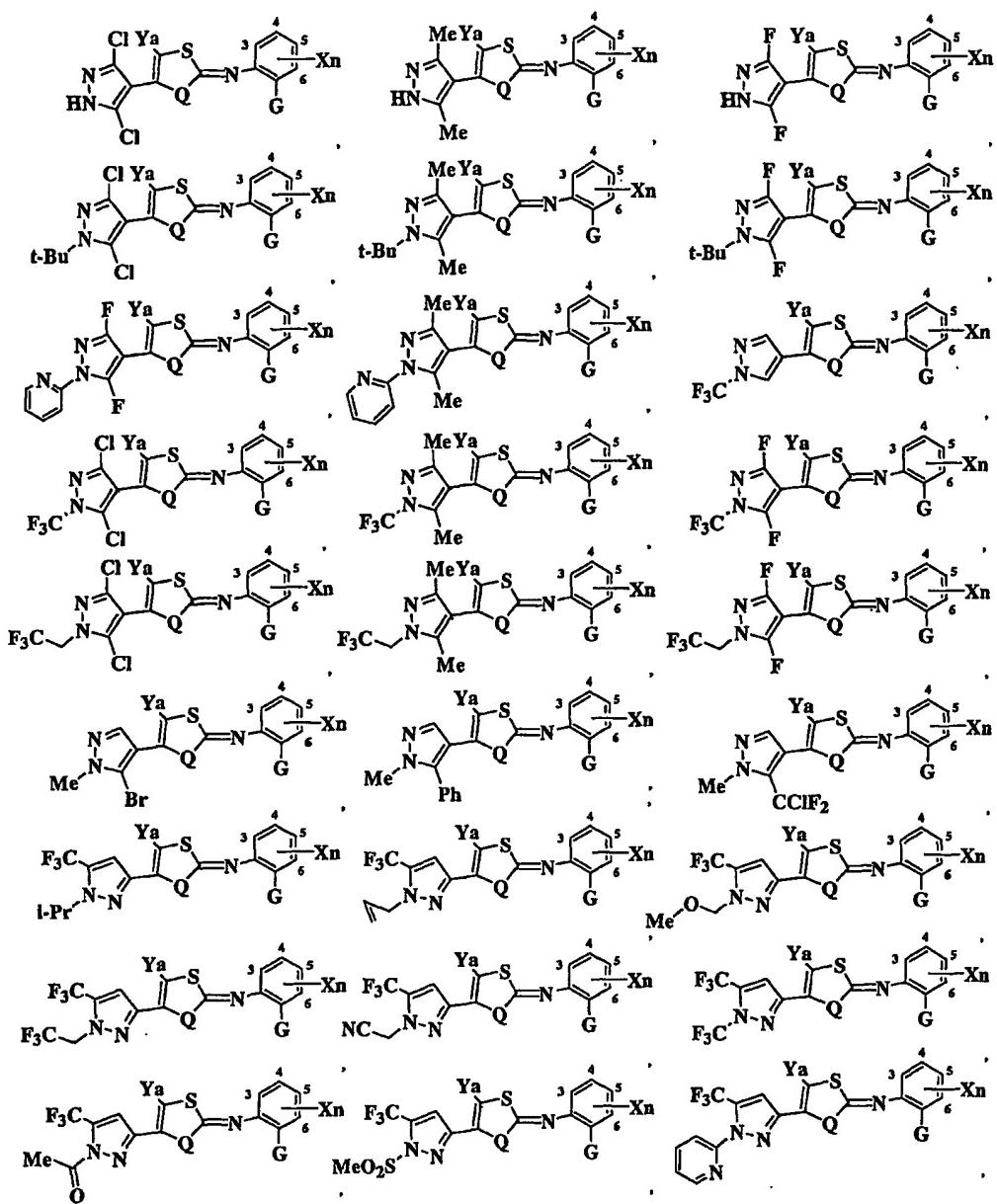


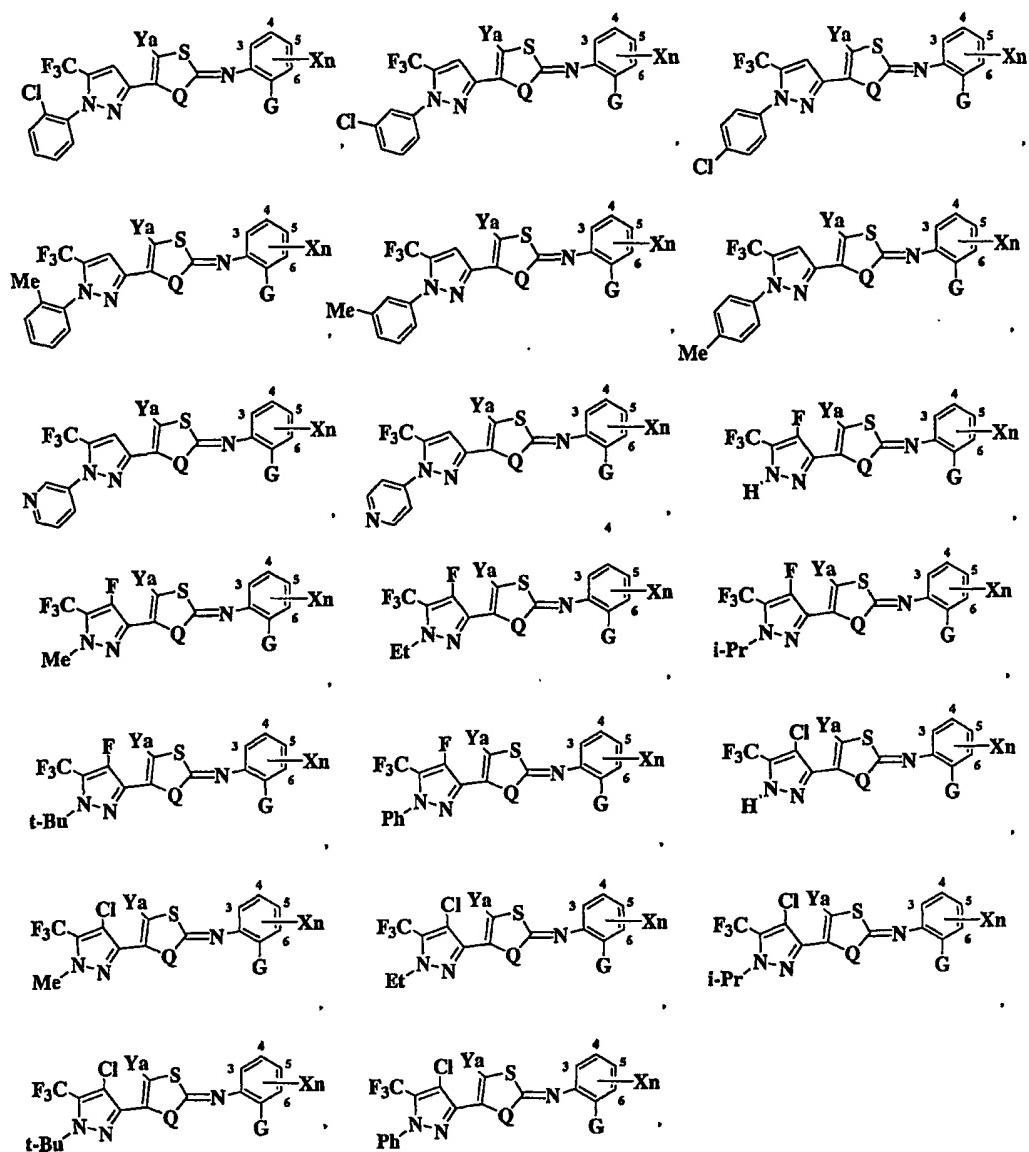


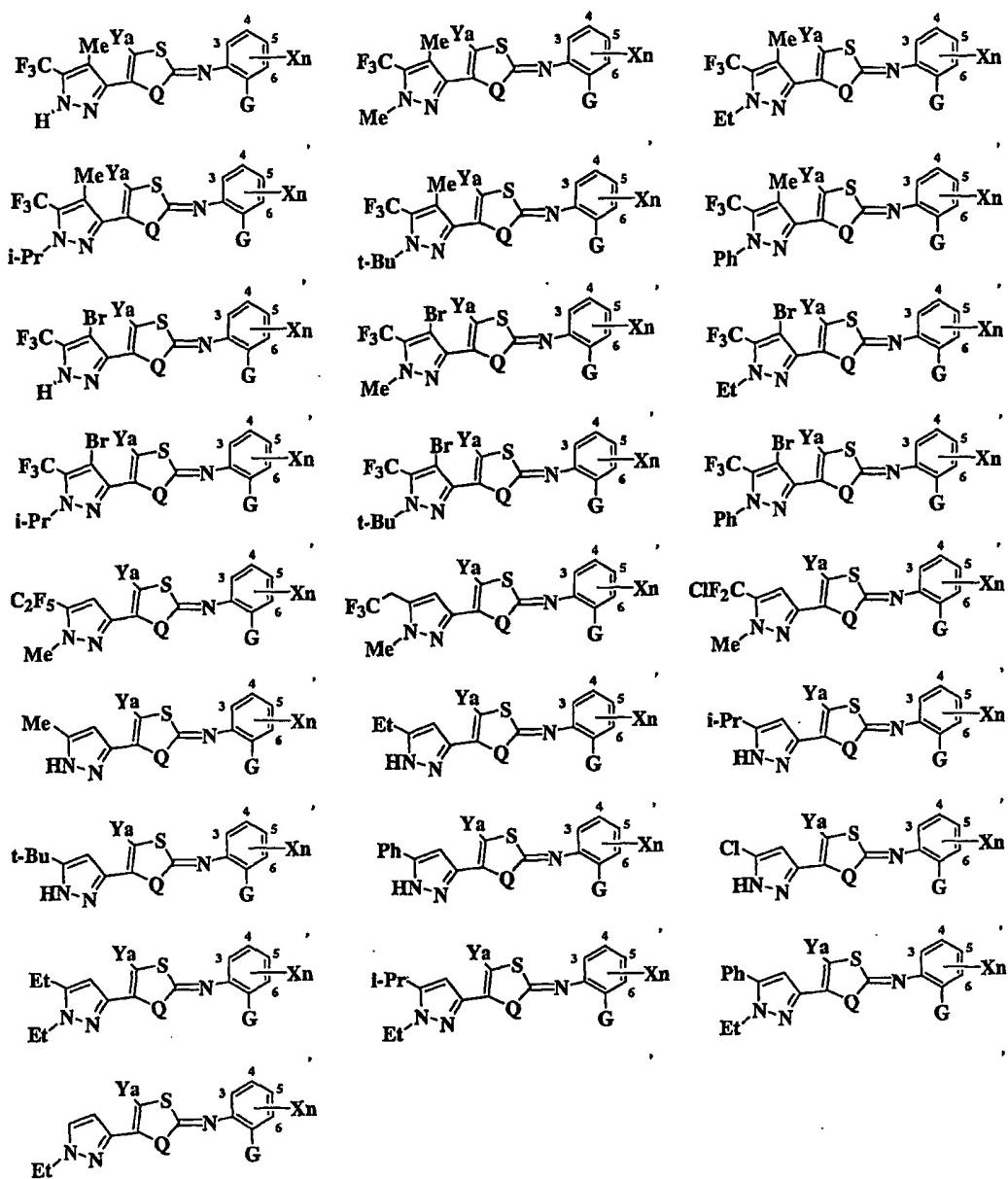


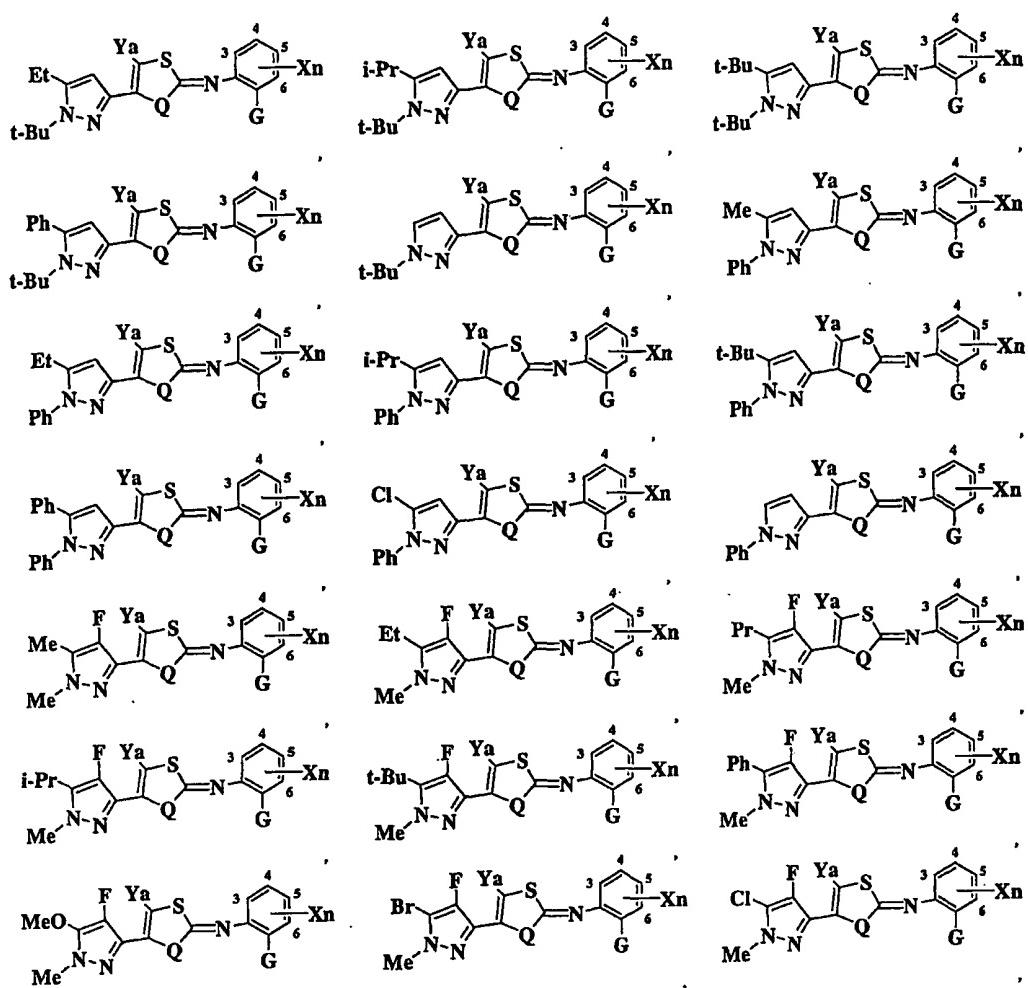


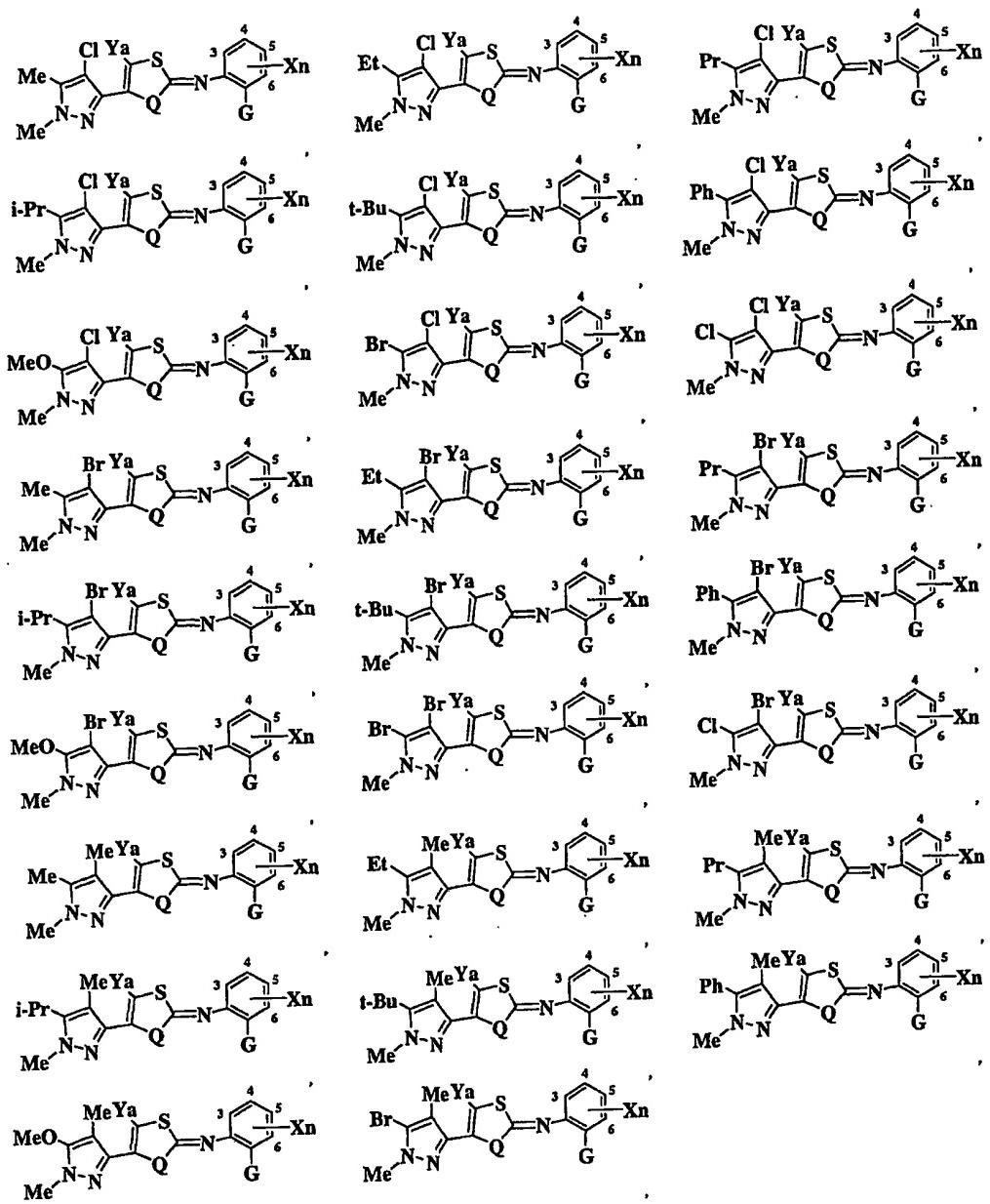


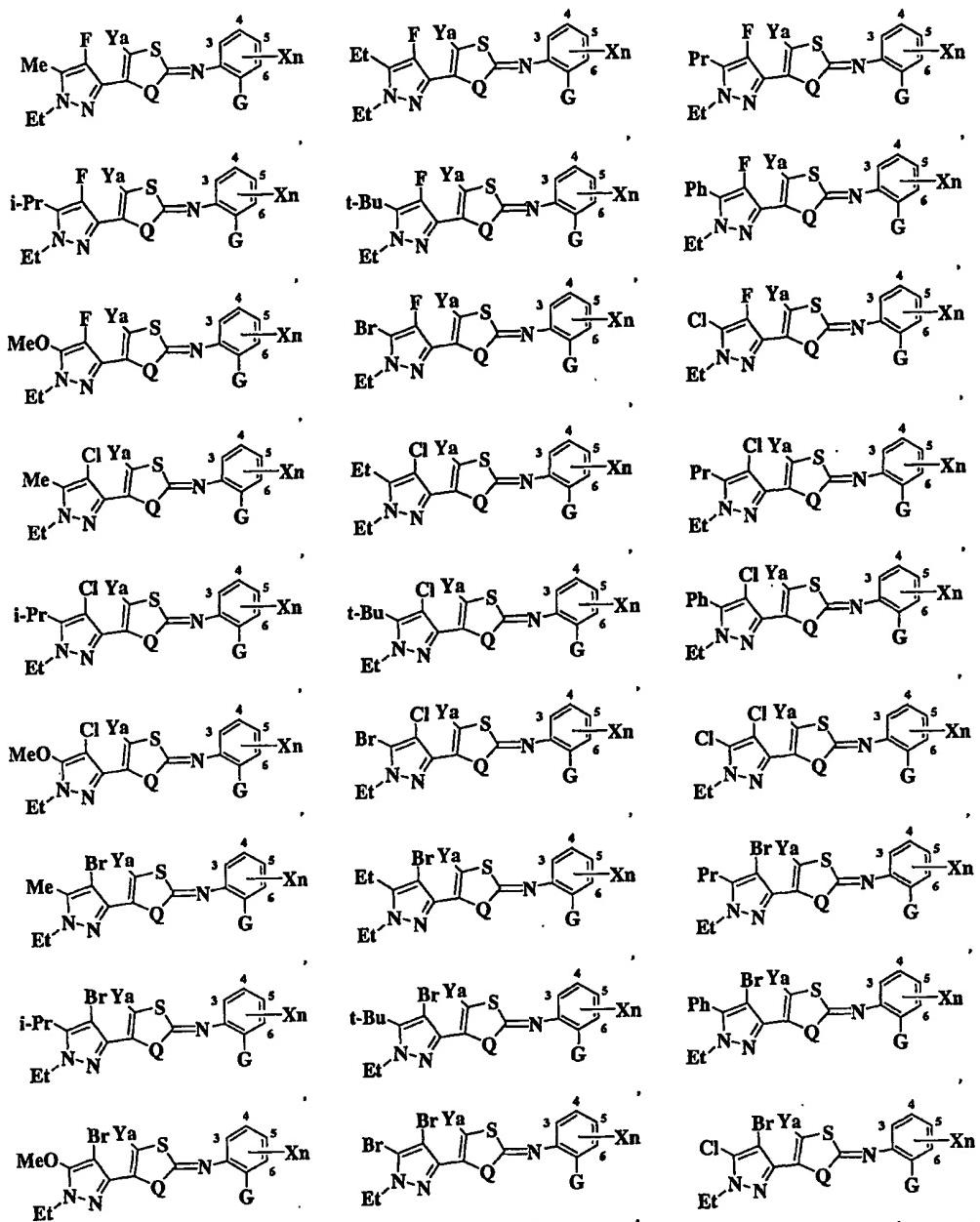


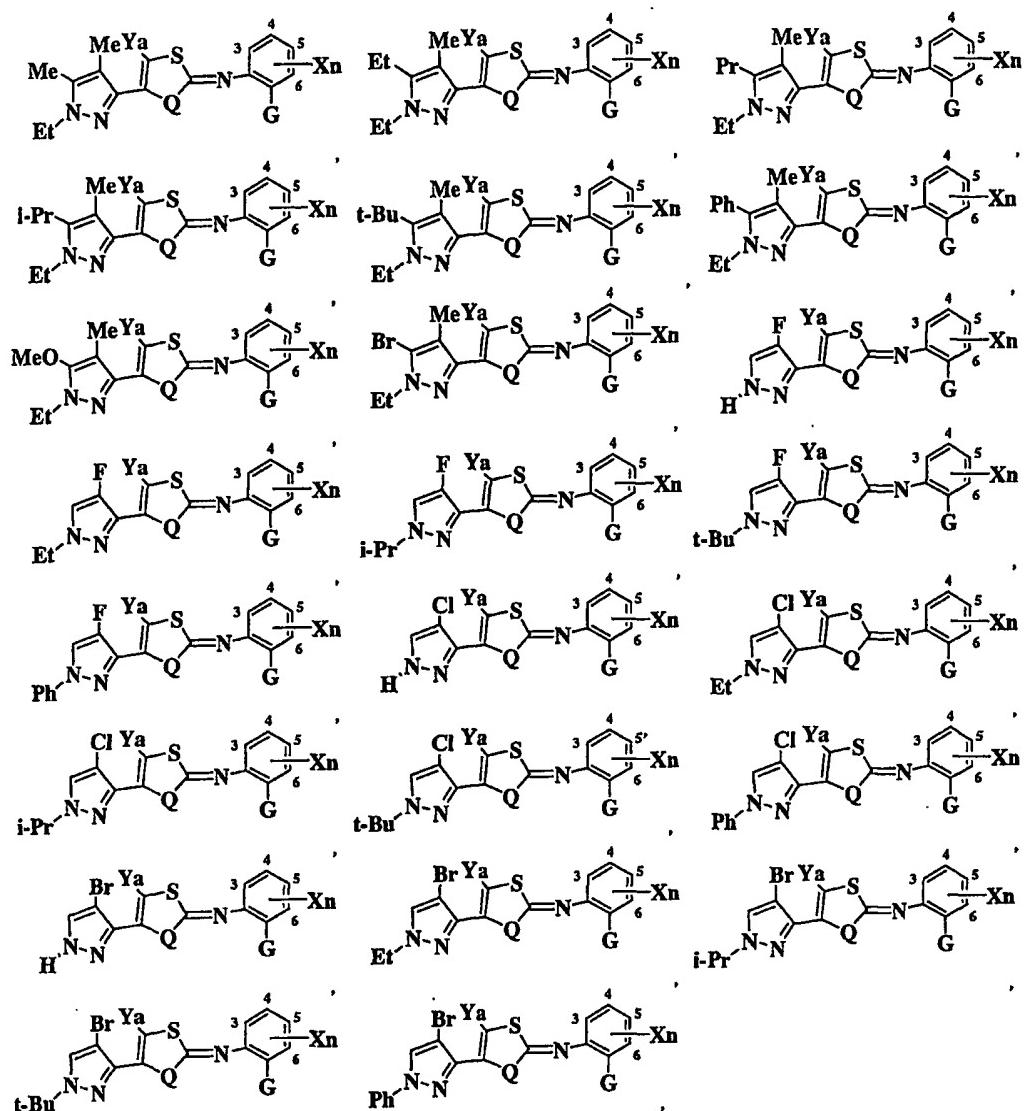


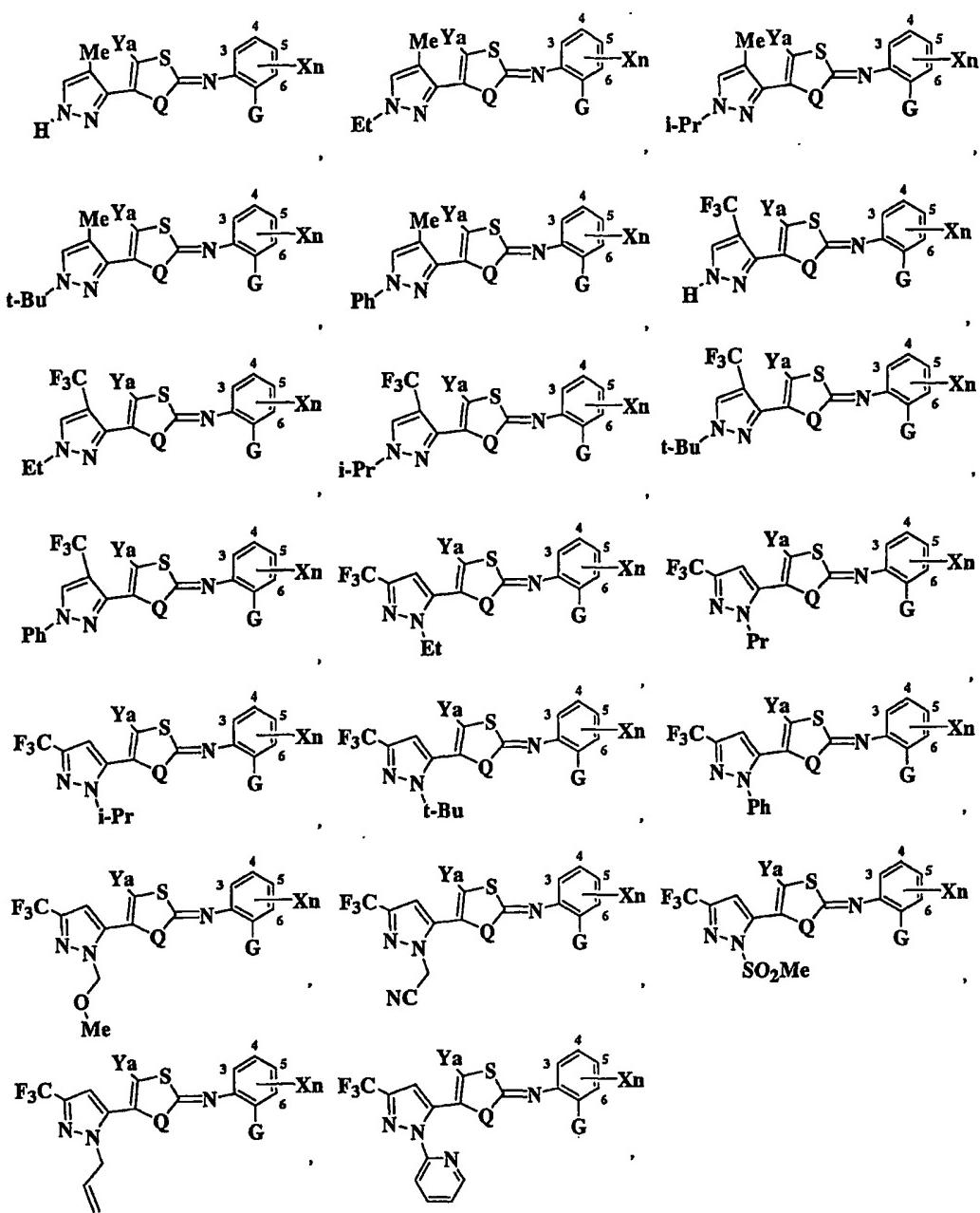


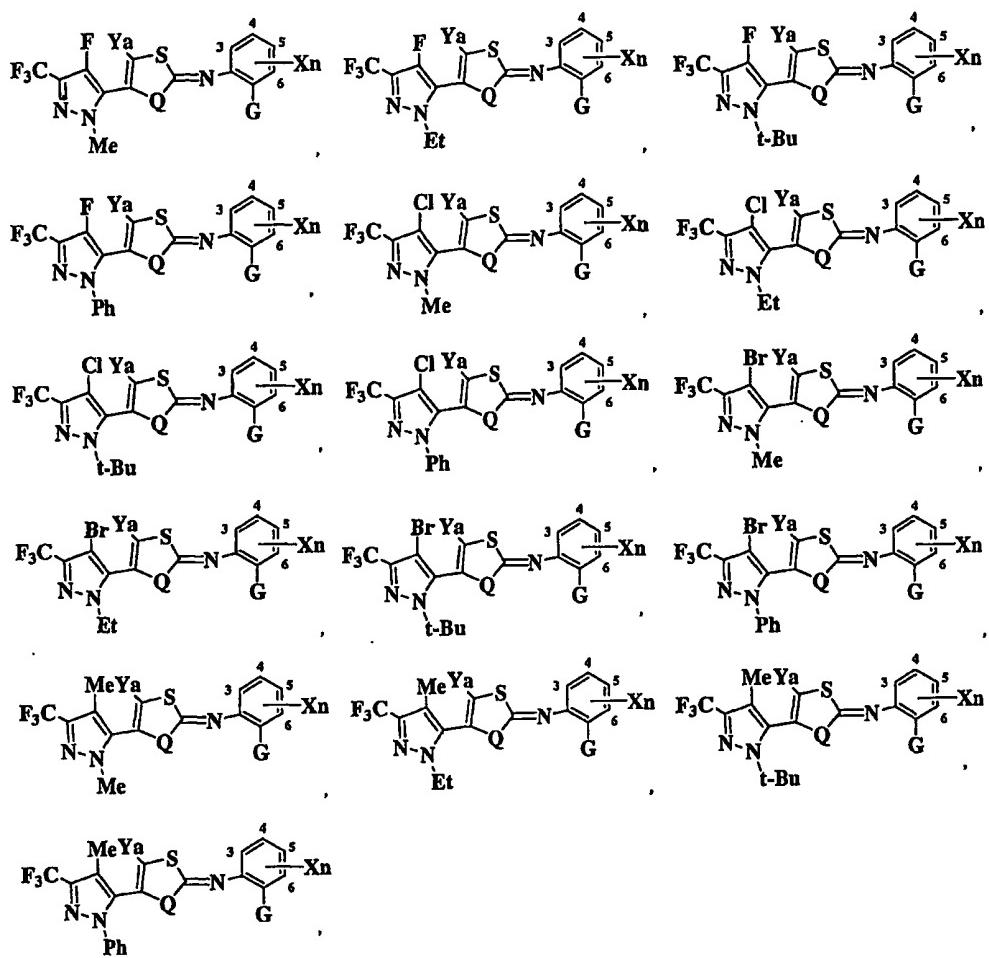


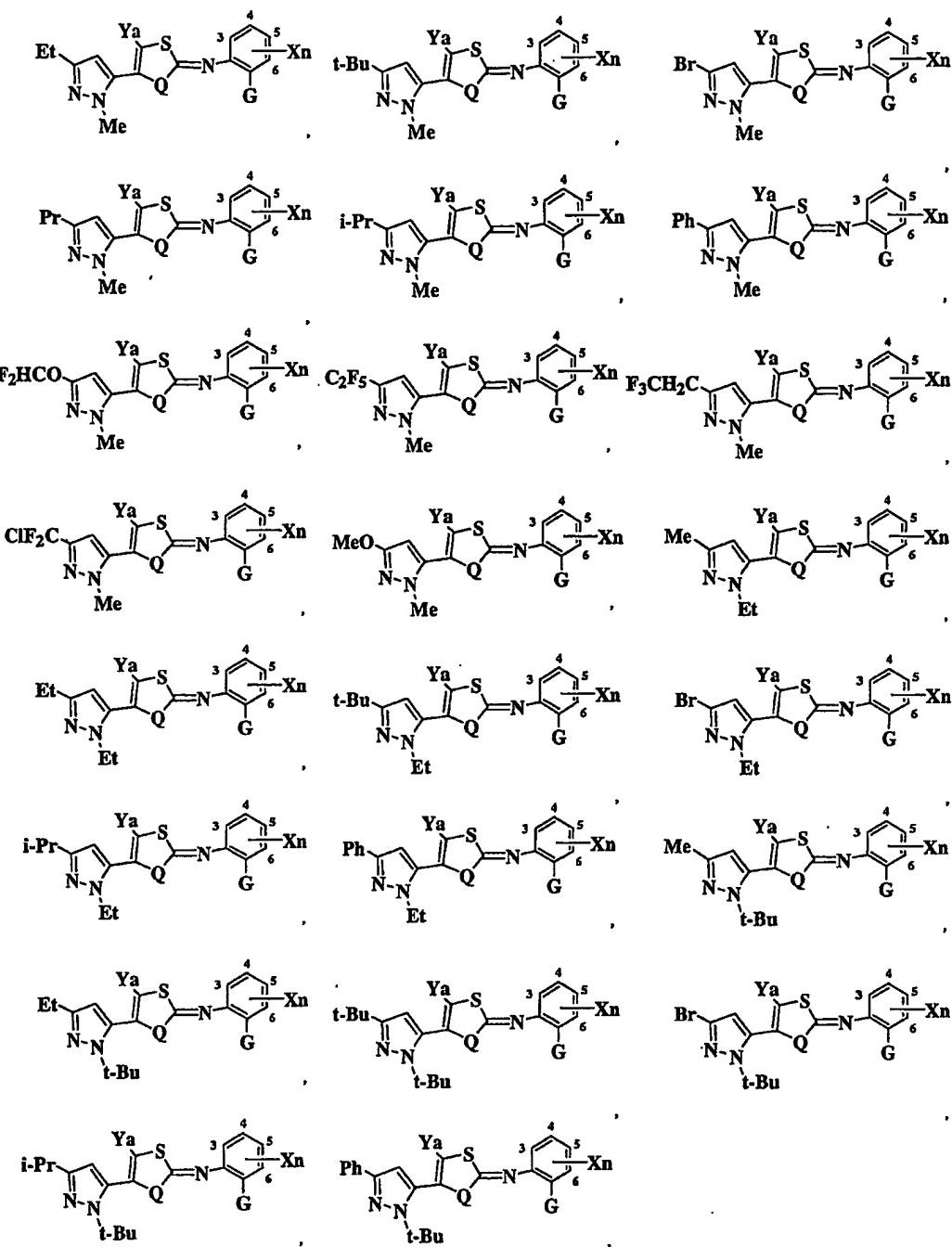


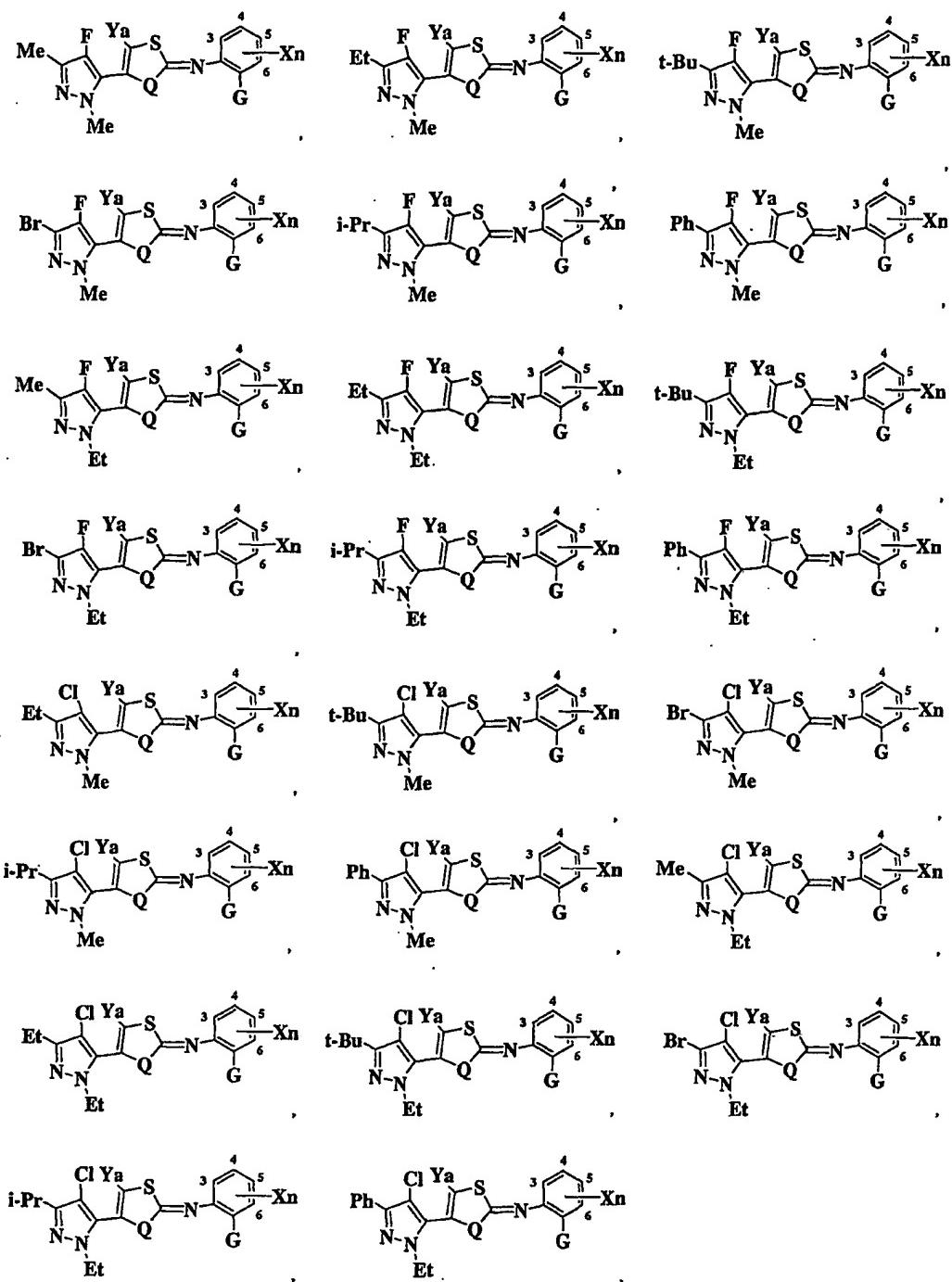


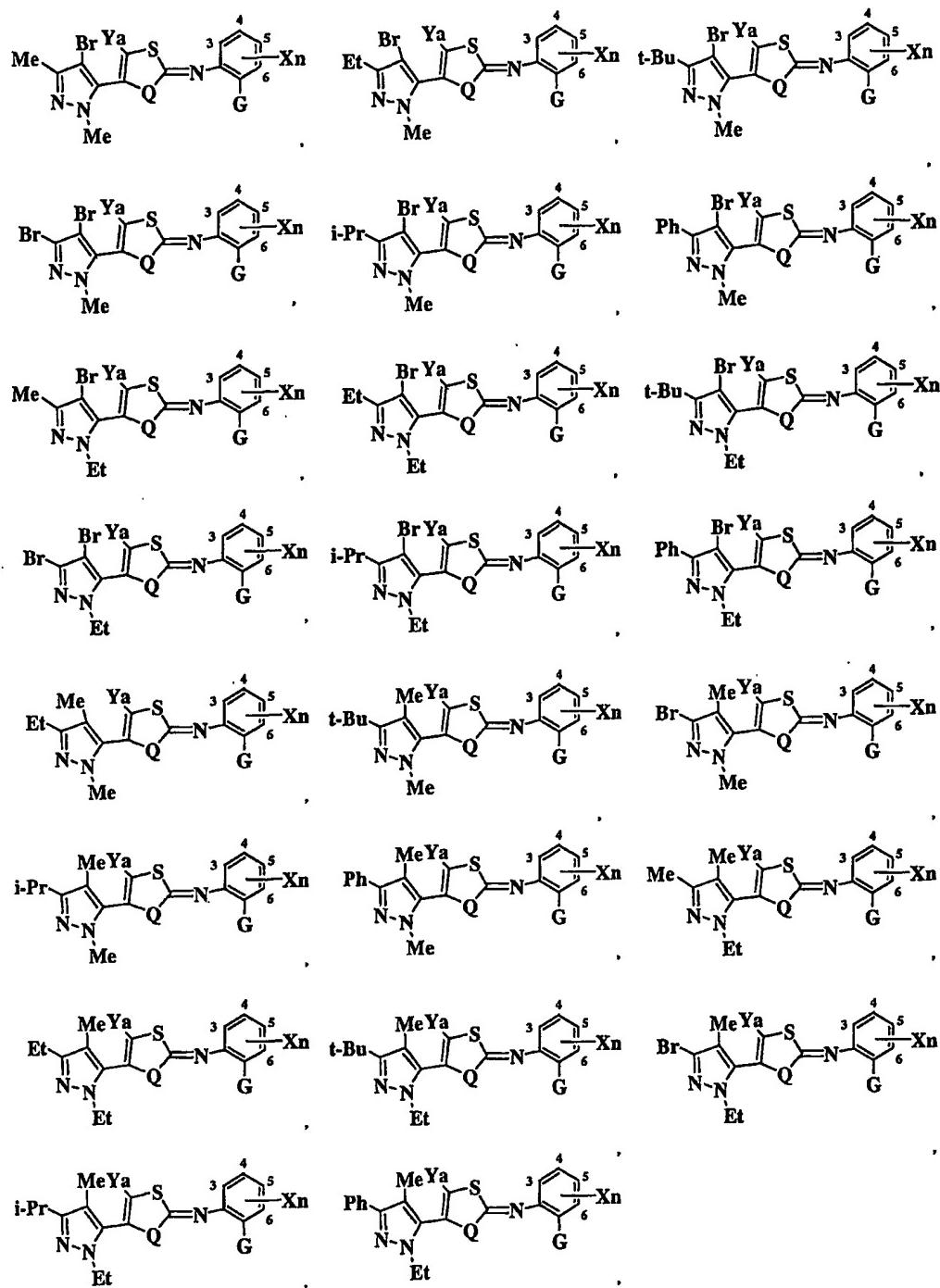


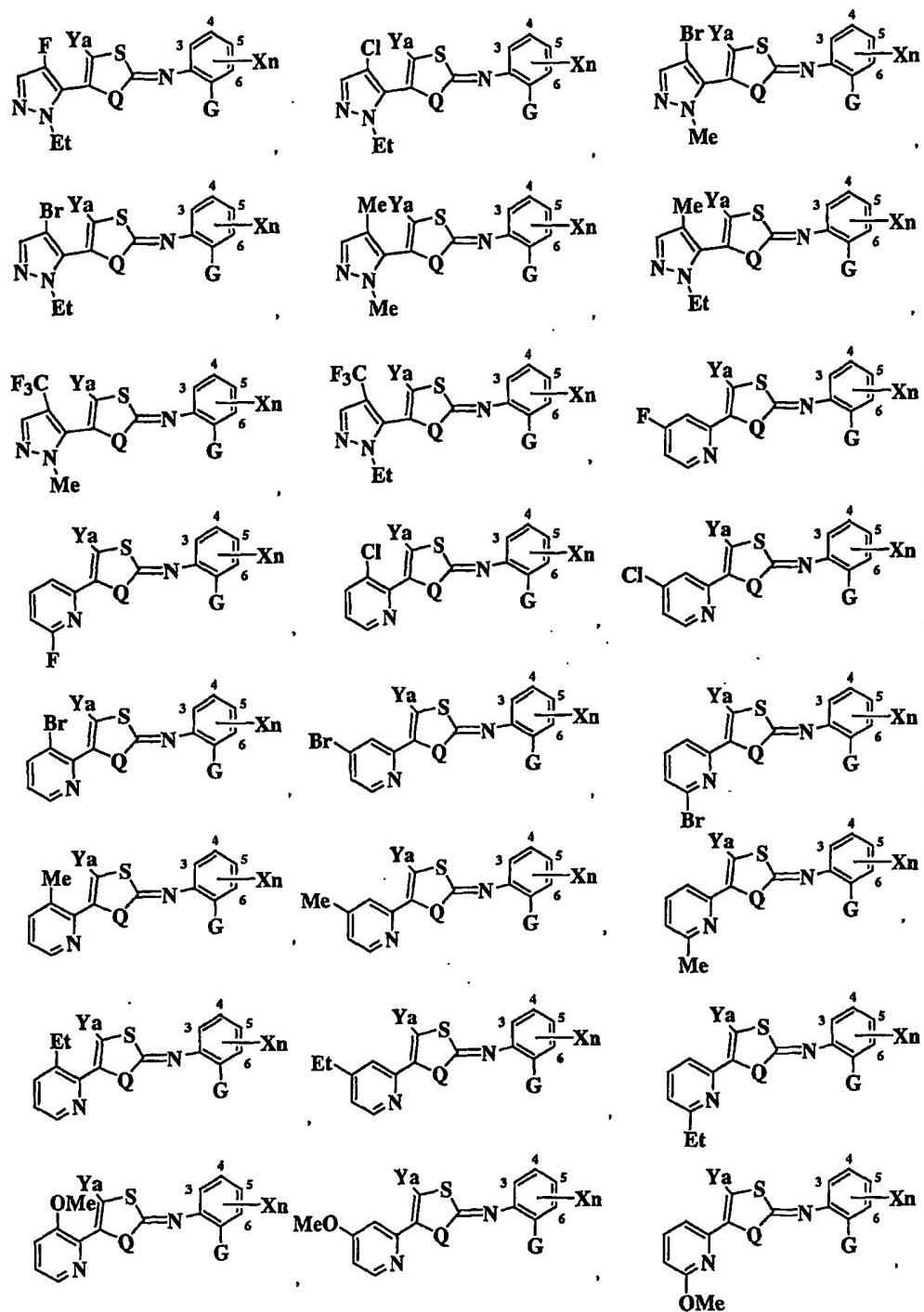


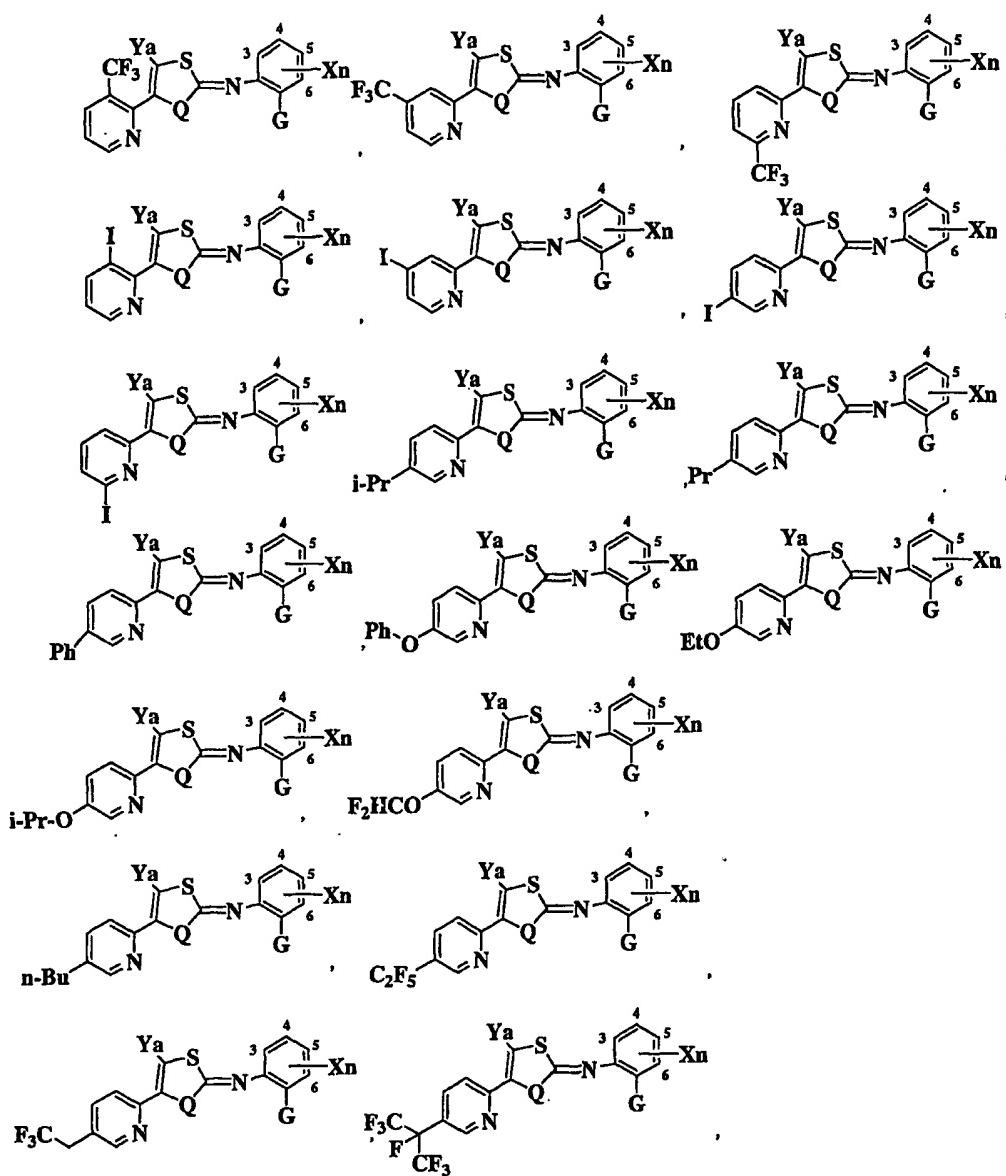


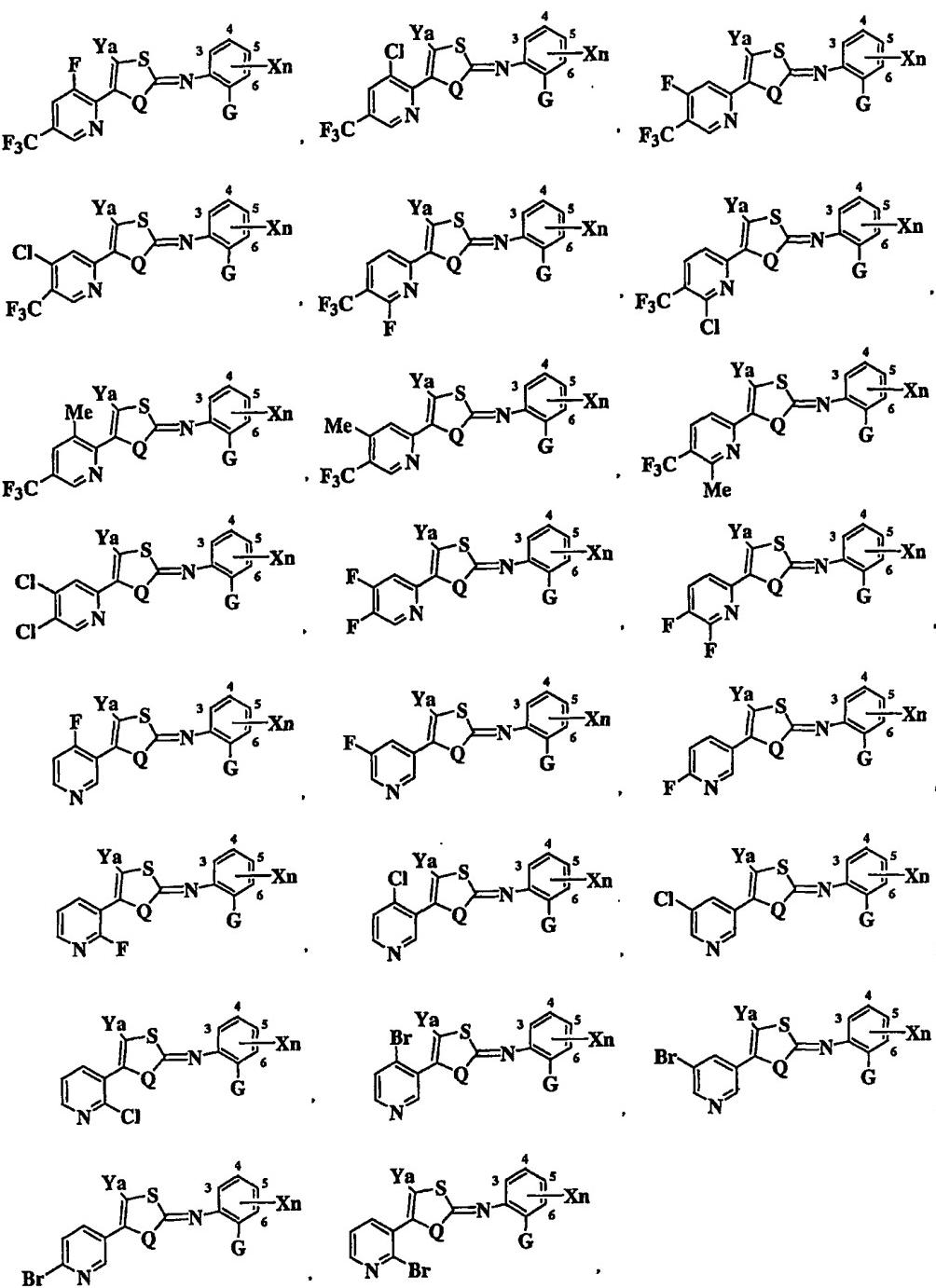


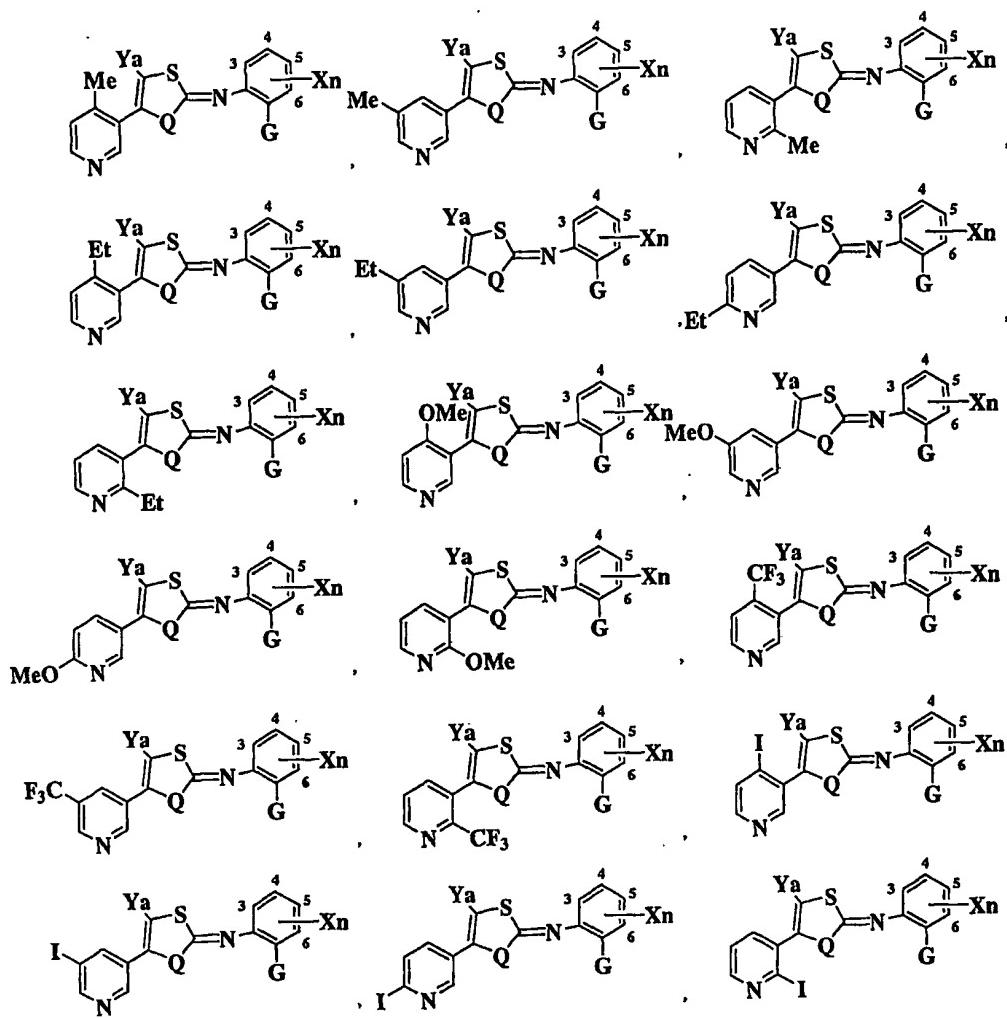


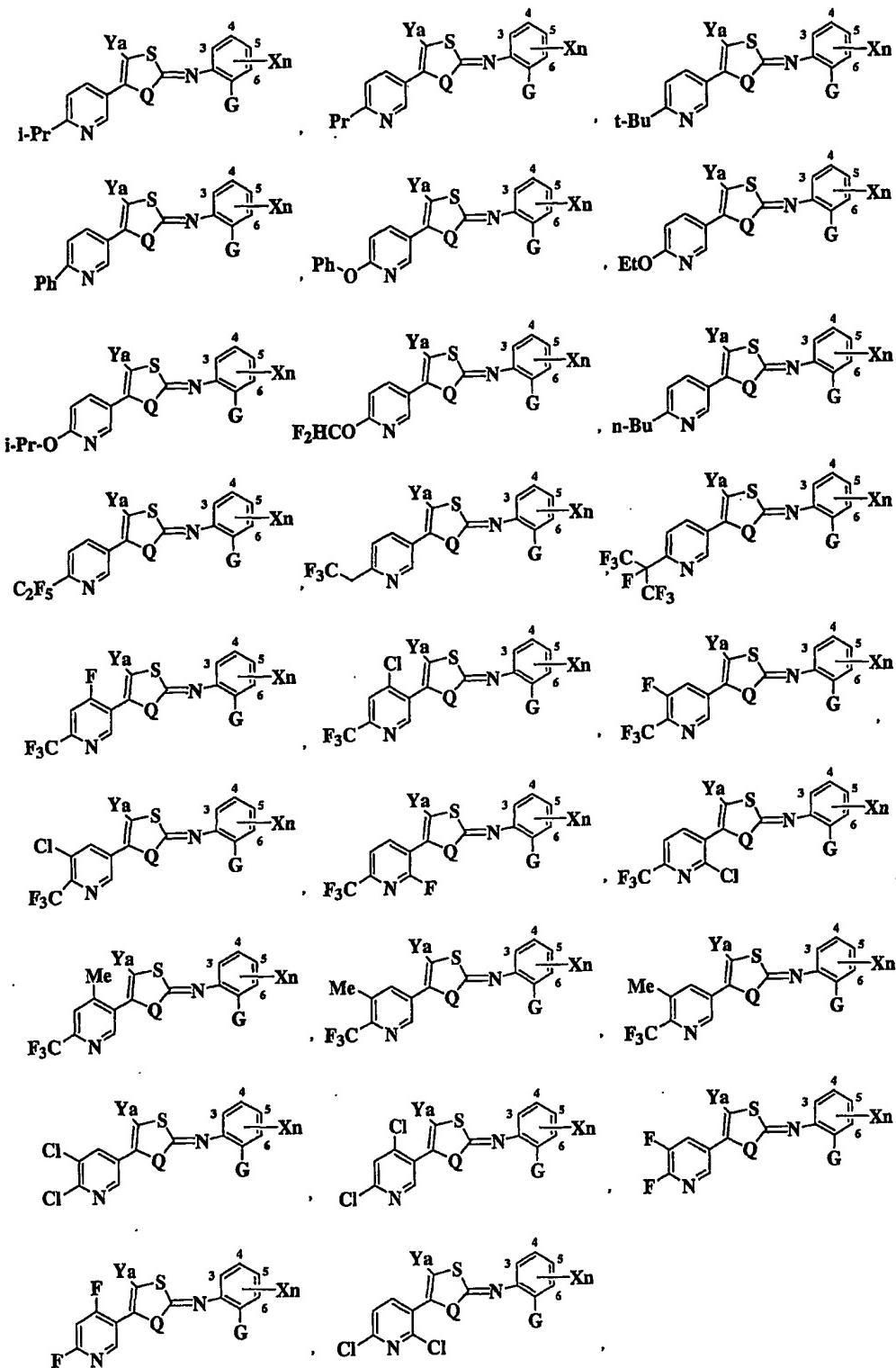


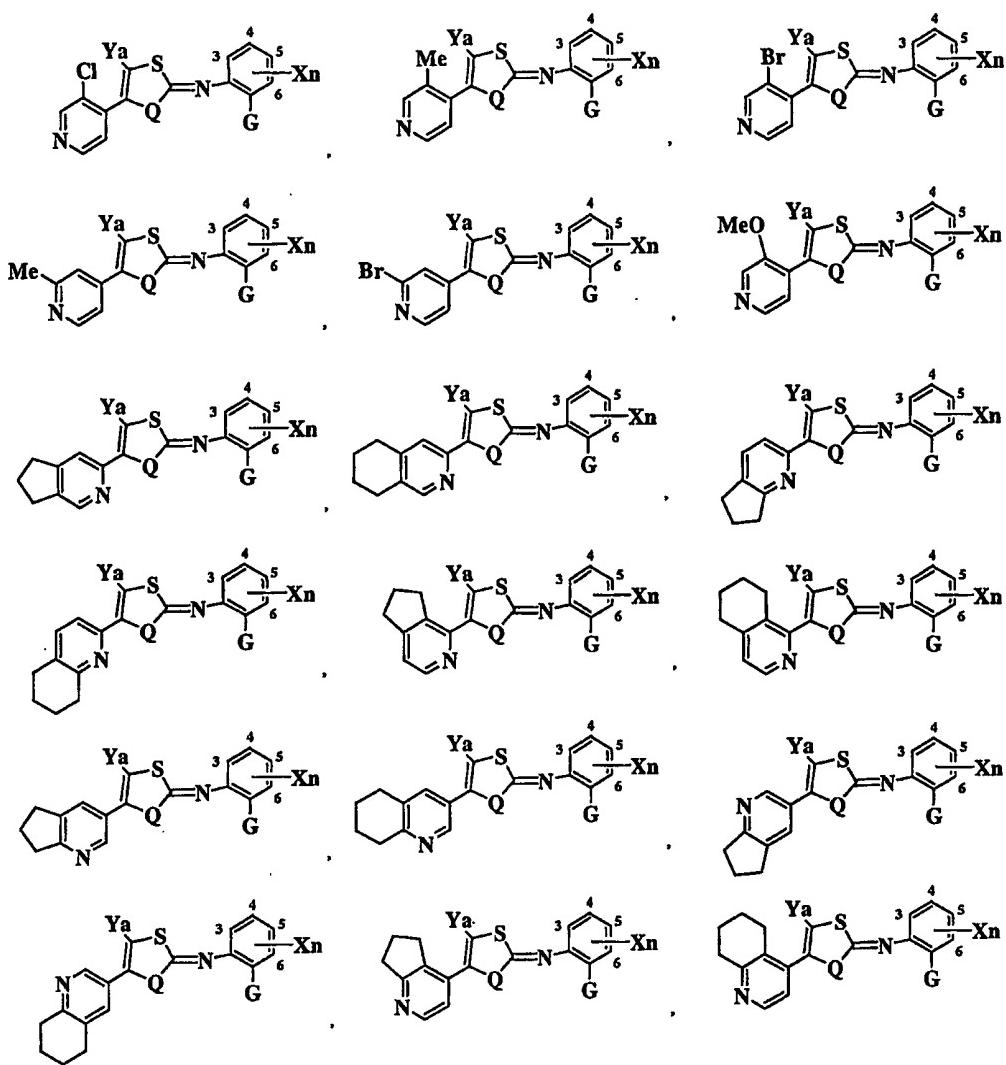


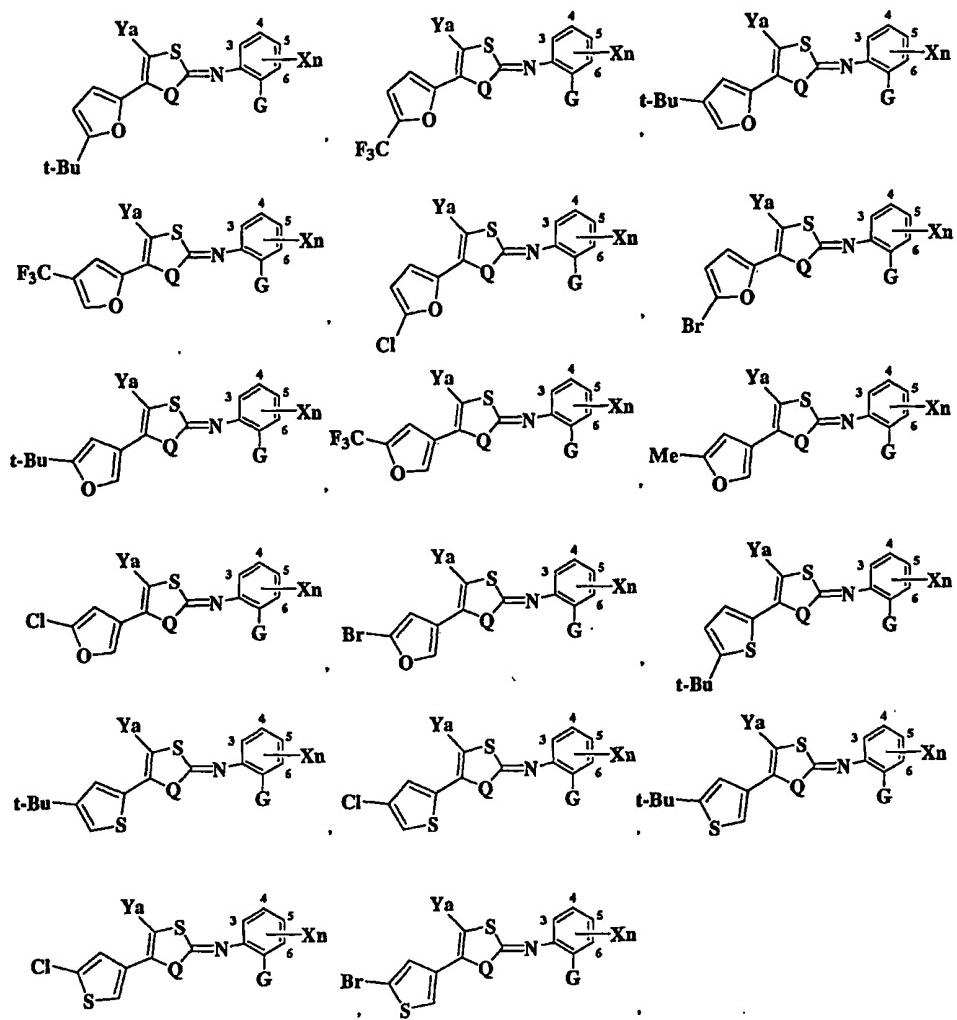


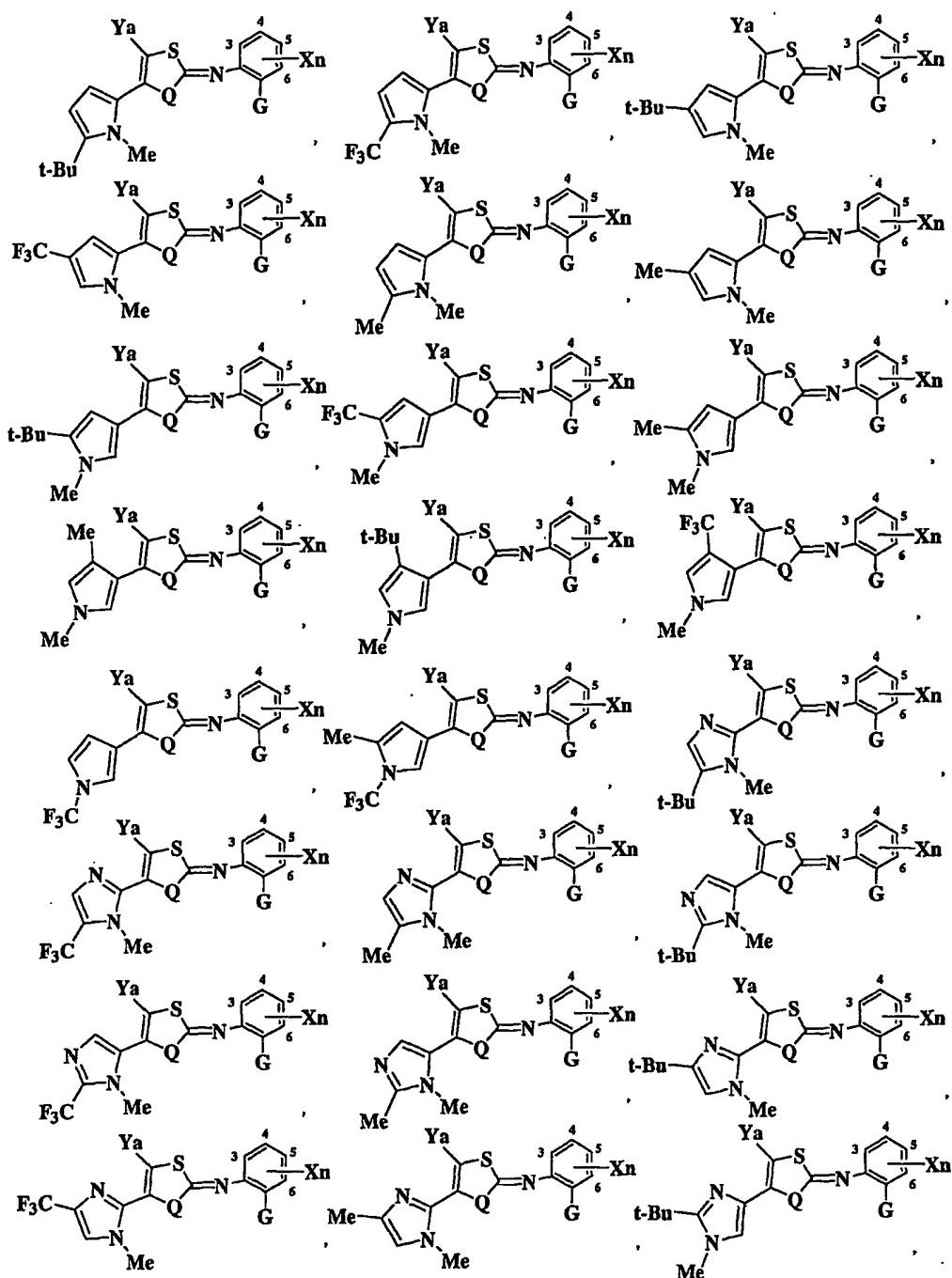


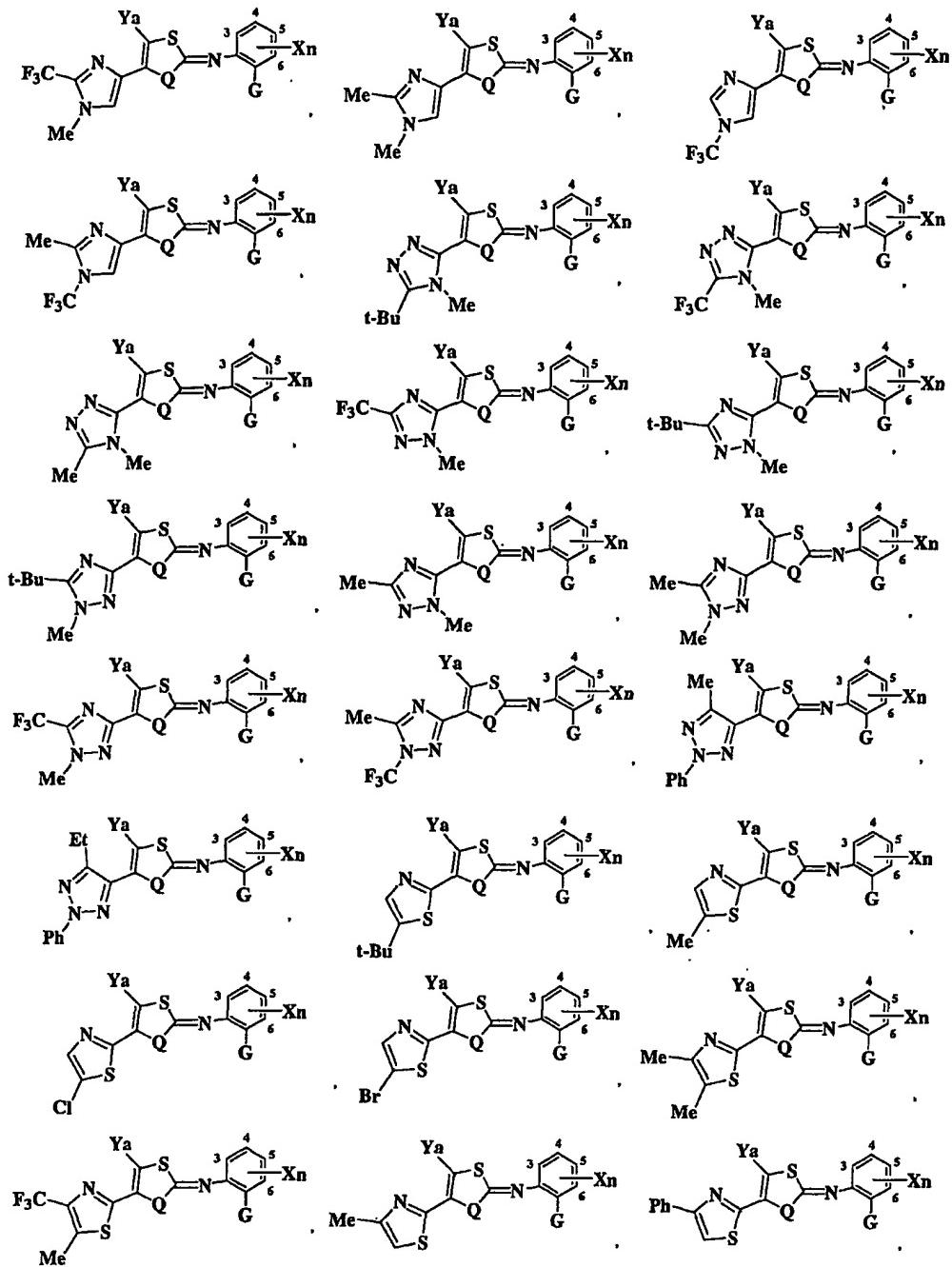


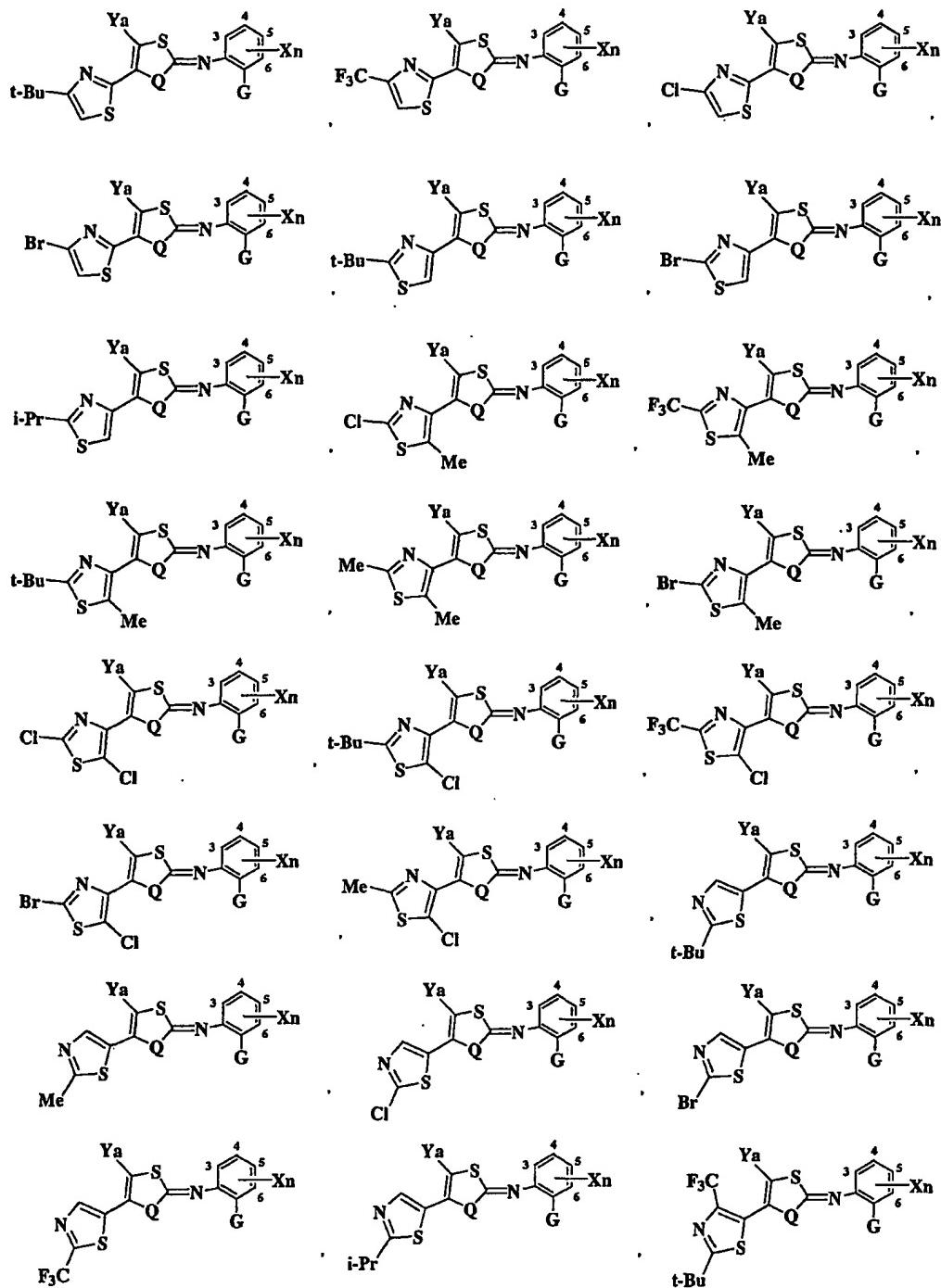


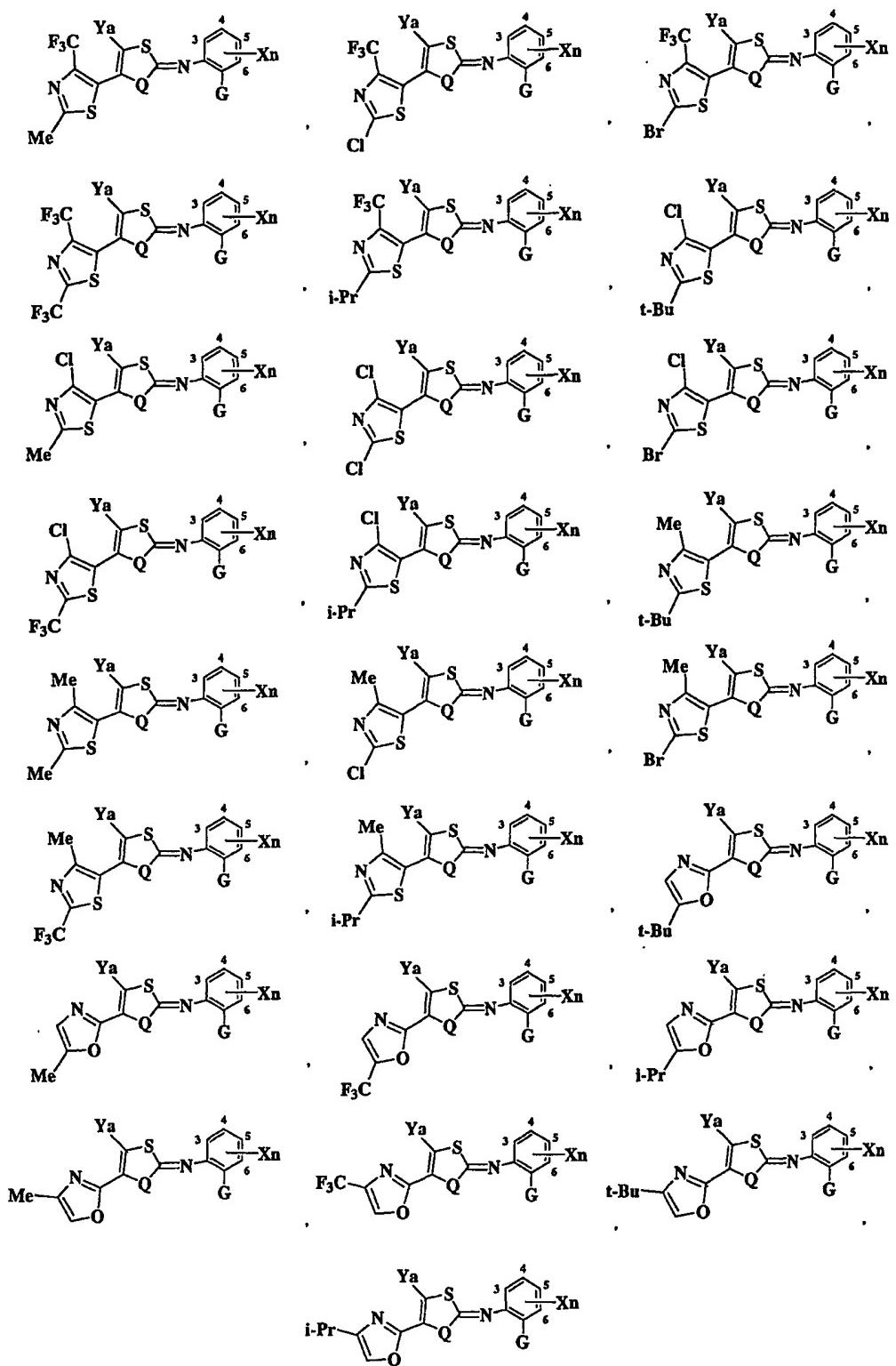


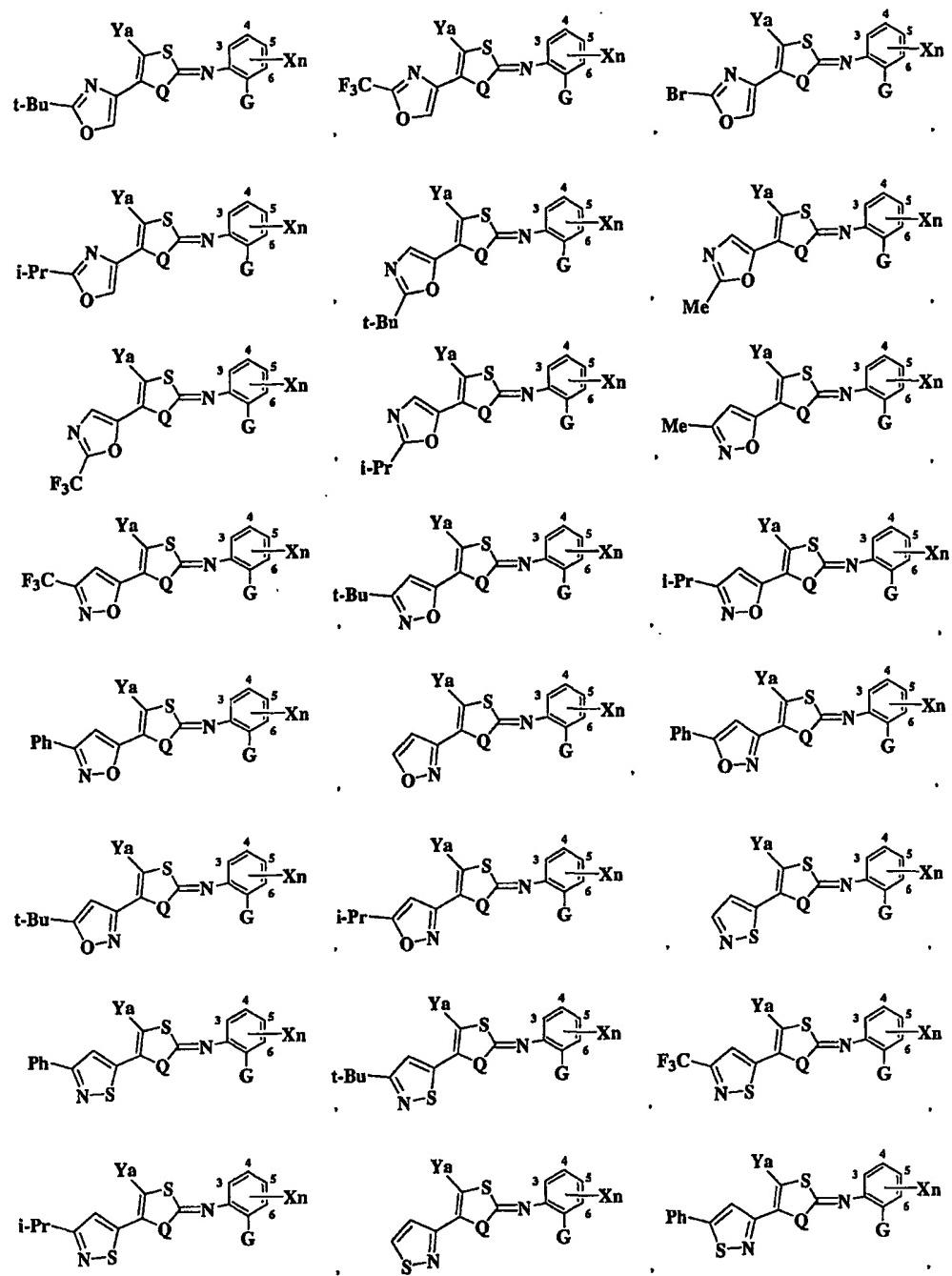


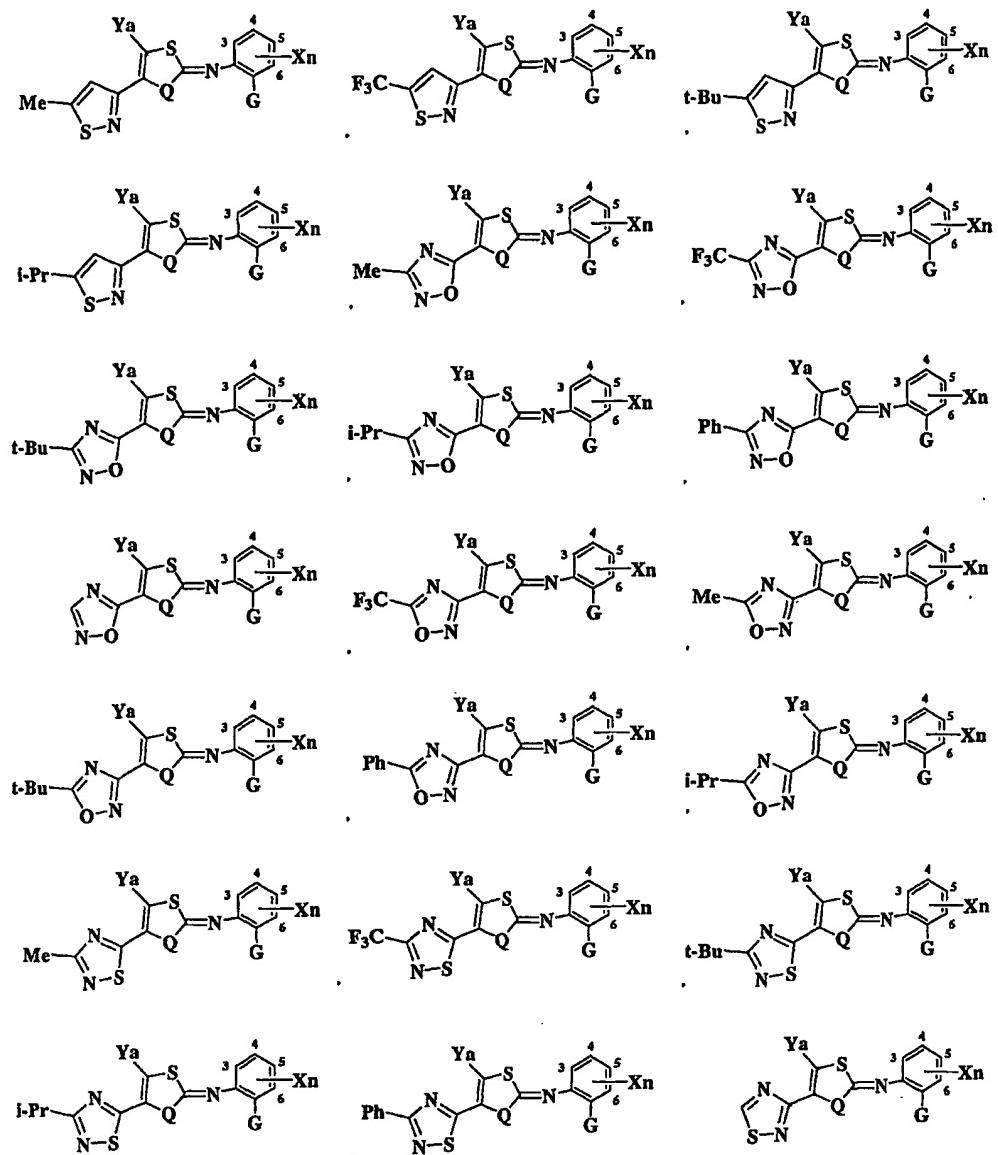


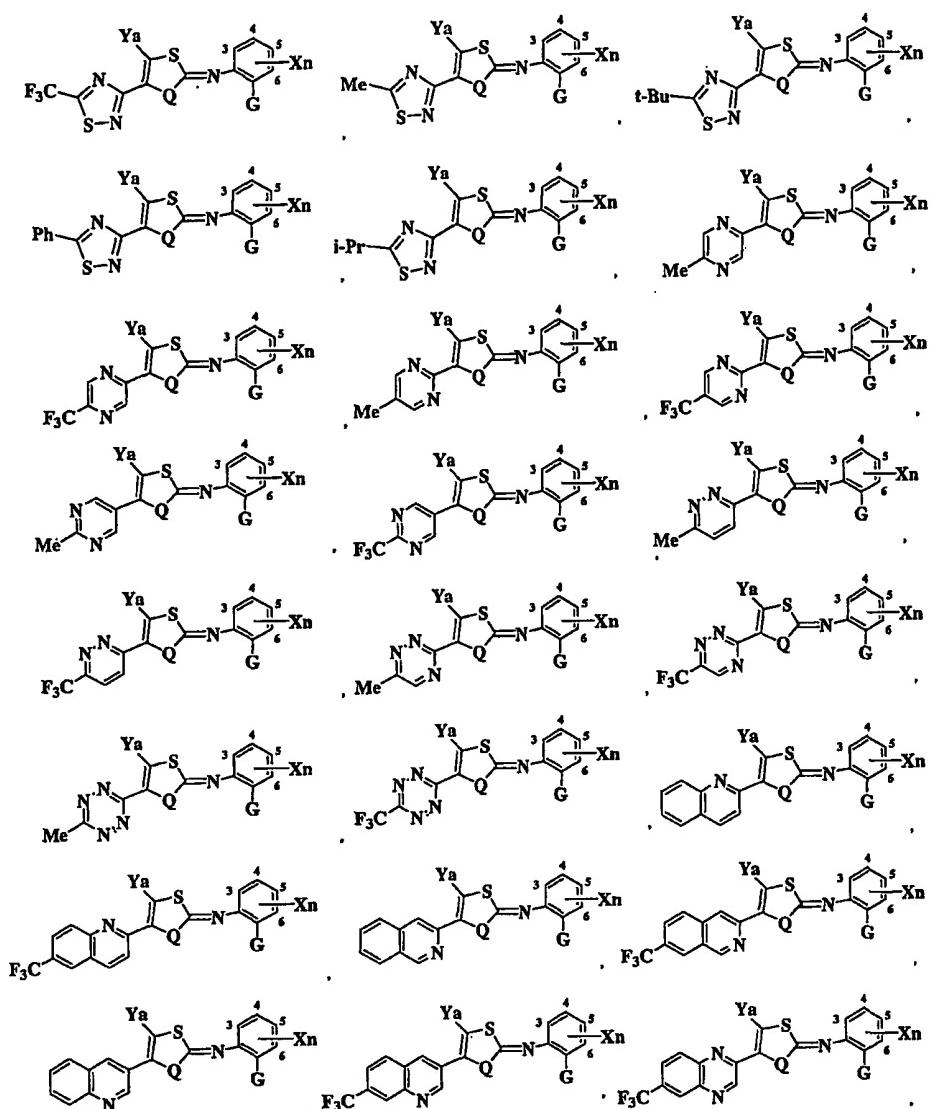


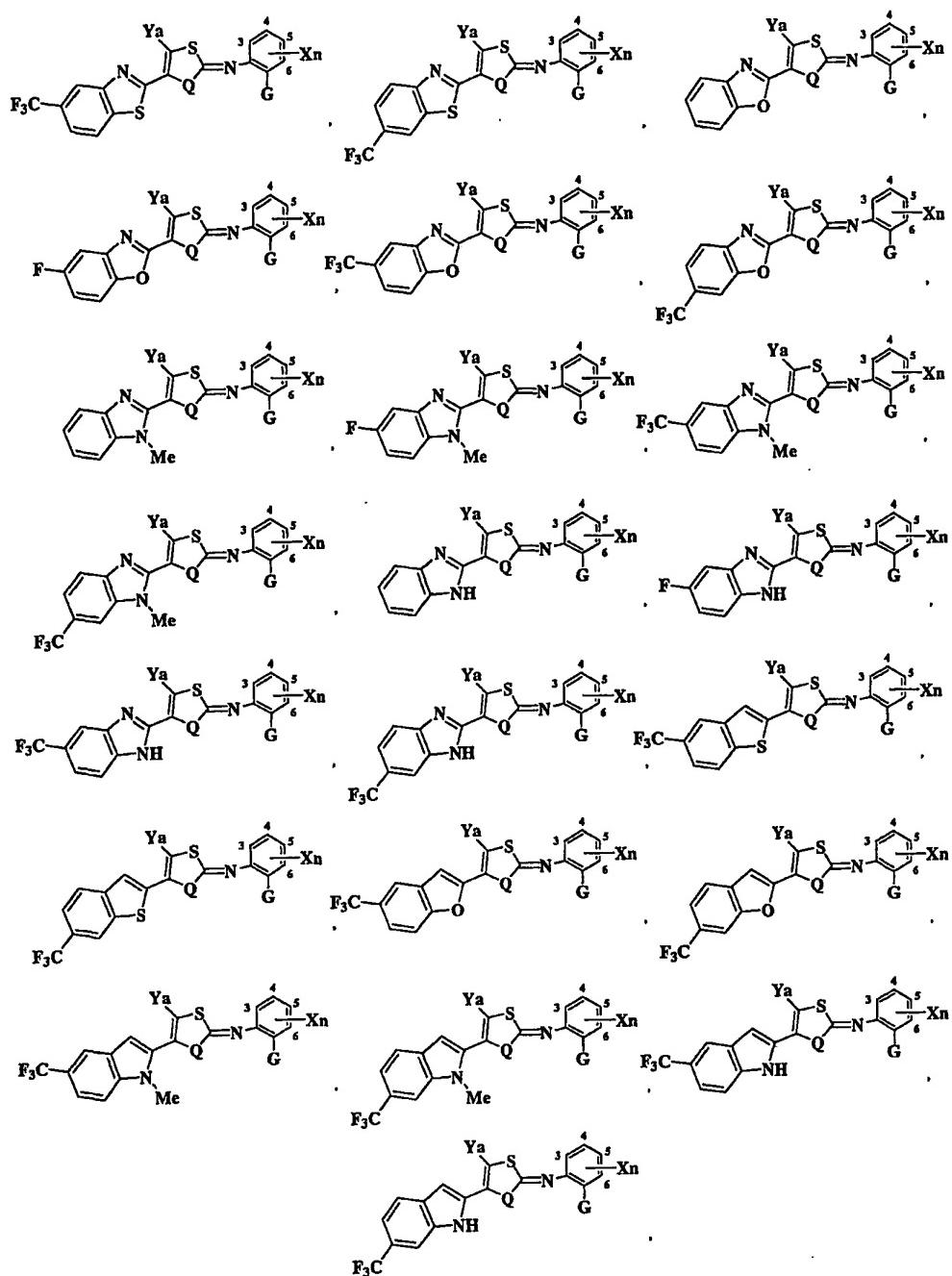


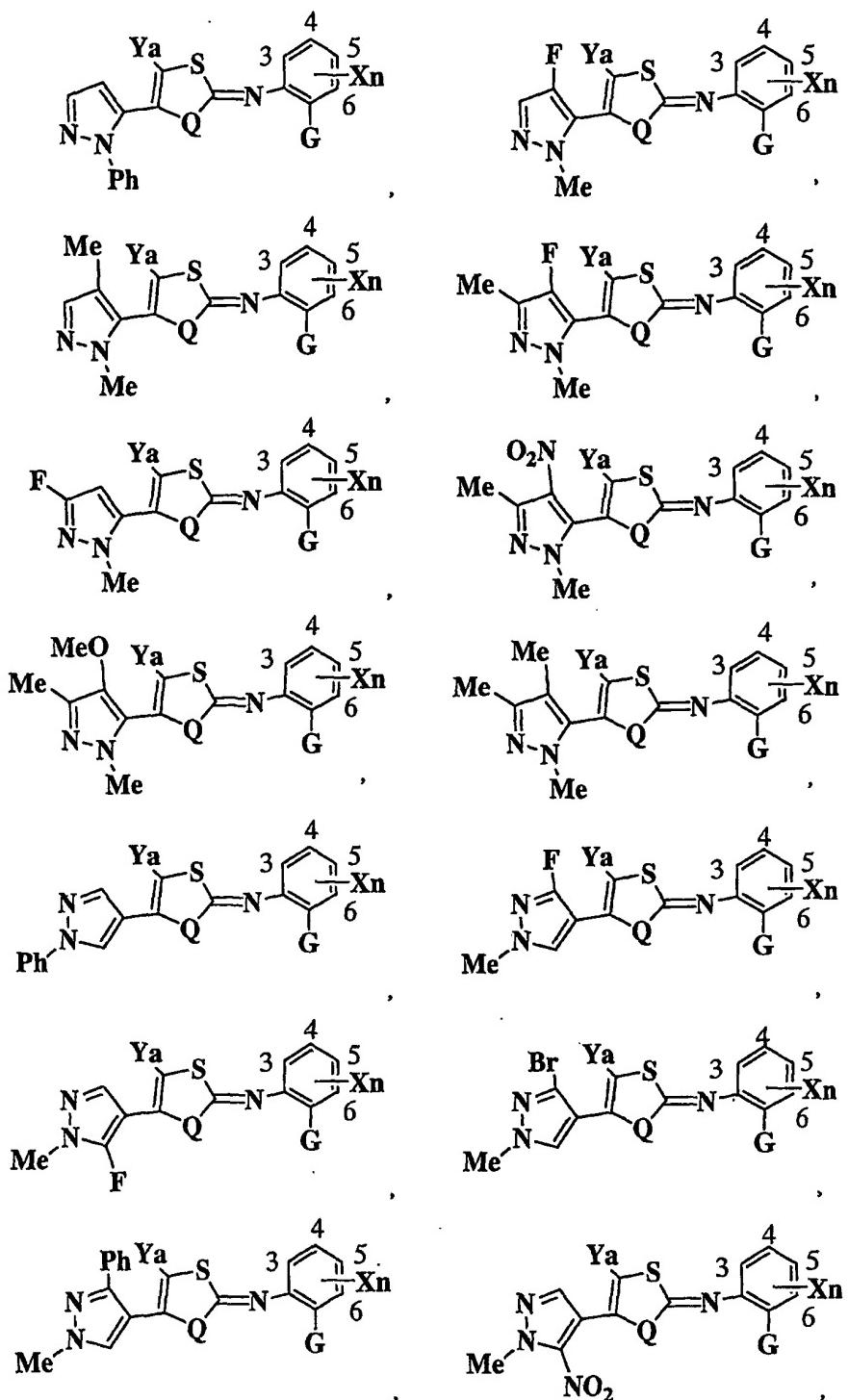












Y a X n Q G

H	H	0	G1
H	3-Me	0	G1
H	4-Me	0	G1
H	5-Me	0	G1
H	6-Me	0	G1
H	4-Et	0	G1
H	4-t-Bu	0	G1
H	4-i-Pr	0	G1
H	4-OMe	0	G1
H	6-OMe	0	G1
H	3-F	0	G1
H	4-F	0	G1
H	5-F	0	G1
H	6-F	0	G1
H	4-Cl	0	G1
H	6-Cl	0	G1
H	4-Br	0	G1
H	4, 6-Me ₂	0	G1
Me	H	0	G1
Me	3-Me	0	G1
Me	4-Me	0	G1
Me	5-Me	0	G1
Me	6-Me	0	G1
Me	4-Et	0	G1
Me	4-t-Bu	0	G1
Me	4-i-Pr	0	G1
Me	4-CF ₃	0	G1
Me	4-OMe	0	G1
Me	6-OMe	0	G1
Me	4-OEt	0	G1
Me	4-SMe	0	G1
Me	4-NMe ₂	0	G1
Me	3-F	0	G1
Me	4-F	0	G1
Me	5-F	0	G1
Me	6-F	0	G1
Me	4-Cl	0	G1
Me	6-Cl	0	G1
Me	4-Br	0	G1
Me	4-I	0	G1
Me	4-CN	0	G1
Me	4, 5-Me ₂	0	G1
Me	4, 6-Me ₂	0	G1
Me	4, 5-(OMe) ₂	0	G1
Et	H	0	G1
Et	4-Me	0	G1
Et	6-Me	0	G1
Et	4-Et	0	G1
Et	4-OMe	0	G1
Et	4-F	0	G1
Et	4-Cl	0	G1
Et	4, 6-Me ₂	0	G1
Pr	H	0	G1
F	H	0	G1
Cl	H	0	G1
Cl	4-Me	0	G1
Cl	6-Me	0	G1

Cl	4-Et	0	G1
Cl	4-OMe	0	G1
Cl	4-F	0	G1
Cl	4-Cl	0	G1
Cl	4, 6-Me ₂	0	G1
Br	H	0	G1
Br	4-Me	0	G1
Br	6-Me	0	G1
Br	4-Et	0	G1
Br	4-OMe	0	G1
Br	4-F	0	G1
Br	4-Cl	0	G1
Br	4, 6-Me ₂	0	G1
H	H	0	G2
H	3-Me	0	G2
H	4-Me	0	G2
H	5-Me	0	G2
H	6-Me	0	G2
H	4-Et	0	G2
H	4-t-Bu	0	G2
H	4-i-Pr	0	G2
H	4-OMe	0	G2
H	6-OMe	0	G2
H	3-F	0	G2
H	4-F	0	G2
H	5-F	0	G2
H	6-F	0	G2
H	4-Cl	0	G2
H	6-Cl	0	G2
H	4-Br	0	G2
H	4, 6-Me ₂	0	G2
Me	H	0	G2
Me	3-Me	0	G2
Me	4-Me	0	G2
Me	5-Me	0	G2
Me	6-Me	0	G2
Me	4-Et	0	G2
Me	4-t-Bu	0	G2
Me	4-i-Pr	0	G2
Me	4-CF ₃	0	G2
Me	4-OMe	0	G2
Me	6-OMe	0	G2
Me	4-OEt	0	G2
Me	4-SMe	0	G2
Me	4-NMe ₂	0	G2
Me	3-F	0	G2
Me	4-F	0	G2
Me	5-F	0	G2
Me	6-F	0	G2
Me	4-Cl	0	G2
Me	6-Cl	0	G2
Me	4-Br	0	G2
Me	4-I	0	G2
Me	4-CN	0	G2
Me	4, 5-Me ₂	0	G2
Me	4, 6-Me ₂	0	G2
Me	4, 5-(OMe) ₂	0	G2
Et	H	0	G2

Et	4-Me	0	G2
Et	6-Me	0	G2
Et	4-Et	0	G2
Et	4-OMe	0	G2
Et	4-F	0	G2
Et	4-Cl	0	G2
Et	4, 6-Me ₂	0	G2
Pr	H	0	G2
F	H	0	G2
Cl	H	0	G2
Cl	4-Me	0	G2
Cl	6-Me	0	G2
Cl	4-Et	0	G2
Cl	4-OMe	0	G2
Cl	4-F	0	G2
Cl	4-Cl	0	G2
Cl	4, 6-Me ₂	0	G2
Br	H	0	G2
Br	4-Me	0	G2
Br	6-Me	0	G2
Br	4-Et	0	G2
Br	4-OMe	0	G2
Br	4-F	0	G2
Br	4-Cl	0	G2
Br	4, 6-Me ₂	0	G2
H	H	0	G4
H	3-Me	0	G4
H	4-Me	0	G4
H	5-Me	0	G4
H	6-Me	0	G4
H	4-Et	0	G4
H	4-t-Bu	0	G4
H	4-i-Pr	0	G4
H	4-OMe	0	G4
H	6-OMe	0	G4
H	3-F	0	G4
H	4-F	0	G4
H	5-F	0	G4
H	6-F	0	G4
H	4-Cl	0	G4
H	6-Cl	0	G4
H	4-Br	0	G4
H	4, 6-Me ₂	0	G4
Me	H	0	G4
Me	3-Me	0	G4
Me	4-Me	0	G4
Me	5-Me	0	G4
Me	6-Me	0	G4
Me	4-Et	0	G4
Me	4-t-Bu	0	G4
Me	4-i-Pr	0	G4
Me	4-CF ₃	0	G4
Me	4-OMe	0	G4
Me	6-OMe	0	G4
Me	4-OEt	0	G4
Me	4-SMe	0	G4
Me	4-NMe ₂	0	G4
Me	3-F	0	G4

Me	4-F	0	G4
Me	5-F	0	G4
Me	6-F	0	G4
Me	4-Cl	0	G4
Me	6-Cl	0	G4
Me	4-Br	0	G4
Me	4-I	0	G4
Me	4-CN	0	G4
Me	4, 5-Me ₂	0	G4
Me	4, 6-Me ₂	0	G4
Me	4, 5-(OMe) ₂	0	G4
Et	H	0	G4
Et	4-Me	0	G4
Et	6-Me	0	G4
Et	4-Et	0	G4
Et	4-OMe	0	G4
Et	4-F	0	G4
Et	4-Cl	0	G4
Et	4, 6-Me ₂	0	G4
Pr	H	0	G4
F	H	0	G4
Cl	H	0	G4
Cl	4-Me	0	G4
Cl	6-Me	0	G4
Cl	4-Et	0	G4
Cl	4-OMe	0	G4
Cl	4-F	0	G4
Cl	4-Cl	0	G4
Cl	4, 6-Me ₂	0	G4
Br	H	0	G4
Br	4-Me	0	G4
Br	6-Me	0	G4
Br	4-Et	0	G4
Br	4-OMe	0	G4
Br	4-F	0	G4
Br	4-Cl	0	G4
Br	4, 6-Me ₂	0	G4
H	H	0	G5
H	3-Me	0	G5
H	4-Me	0	G5
H	5-Me	0	G5
H	6-Me	0	G5
H	4-Et	0	G5
H	4-t-Bu	0	G5
H	4-i-Pr	0	G5
H	4-OMe	0	G5
H	6-OMe	0	G5
H	3-F	0	G5
H	4-F	0	G5
H	5-F	0	G5
H	6-F	0	G5
H	4-Cl	0	G5
H	6-Cl	0	G5
H	4-Br	0	G5
H	4, 6-Me ₂	0	G5
Me	H	0	G5
Me	3-Me	0	G5
Me	4-Me	0	G5

Me	5-Me	0	G5
Me	6-Me	0	G5
Me	4-Et	0	G5
Me	4-t-Bu	0	G5
Me	4-i-Pr	0	G5
Me	4-CF ₃	0	G5
Me	4-OMe	0	G5
Me	6-OMe	0	G5
Me	4-OEt	0	G5
Me	4-SMe	0	G5
Me	4-NMe ₂	0	G5
Me	3-F	0	G5
Me	4-F	0	G5
Me	5-F	0	G5
Me	6-F	0	G5
Me	4-Cl	0	G5
Me	6-Cl	0	G5
Me	4-Br	0	G5
Me	4-I	0	G5
Me	4-CN	0	G5
Me	4, 5-Me ₂	0	G5
Me	4, 6-Me ₂	0	G5
Me	4, 5-(OMe) ₂	0	G5
Et	H	0	G5
Et	4-Me	0	G5
Et	6-Me	0	G5
Et	4-Et	0	G5
Et	4-OMe	0	G5
Et	4-F	0	G5
Et	4-Cl	0	G5
Et	4, 6-Me ₂	0	G5
Pr	H	0	G5
F	H	0	G5
Cl	H	0	G5
Cl	4-Me	0	G5
Cl	6-Me	0	G5
Cl	4-Et	0	G5
Cl	4-OMe	0	G5
Cl	4-F	0	G5
Cl	4-Cl	0	G5
Cl	4, 6-Me ₂	0	G5
Br	H	0	G5
Br	4-Me	0	G5
Br	6-Me	0	G5
Br	4-Et	0	G5
Br	4-OMe	0	G5
Br	4-F	0	G5
Br	4-Cl	0	G5
Br	4, 6-Me ₂	0	G5
H	H	0	G6
H	3-Me	0	G6
H	4-Me	0	G6
H	5-Me	0	G6
H	6-Me	0	G6
H	4-Et	0	G6
H	4-t-Bu	0	G6
H	4-i-Pr	0	G6
H	4-OMe	0	G6

H	6-OMe	0	G6
H	3-F	0	G6
H	4-F	0	G6
H	5-F	0	G6
H	6-F	0	G6
H	4-Cl	0	G6
H	6-Cl	0	G6
H	4-Br	0	G6
H	4, 6-Me ₂	0	G6
Me	H	0	G6
Me	3-Me	0	G6
Me	4-Me	0	G6
Me	5-Me	0	G6
Me	6-Me	0	G6
Me	4-Et	0	G6
Me	4-t-Bu	0	G6
Me	4-i-Pr	0	G6
Me	4-CF ₃	0	G6
Me	4-OMe	0	G6
Me	6-OMe	0	G6
Me	4-OEt	0	G6
Me	4-SMe	0	G6
Me	4-NMe ₂	0	G6
Me	3-F	0	G6
Me	4-F	0	G6
Me	5-F	0	G6
Me	6-F	0	G6
Me	4-Cl	0	G6
Me	6-Cl	0	G6
Me	4-Br	0	G6
Me	4-I	0	G6
Me	4-CN	0	G6
Me	4, 5-Me ₂	0	G6
Me	4, 6-Me ₂	0	G6
Me	4, 5-(OMe) ₂	0	G6
Et	H	0	G6
Et	4-Me	0	G6
Et	6-Me	0	G6
Et	4-Et	0	G6
Et	4-OMe	0	G6
Et	4-F	0	G6
Et	4-Cl	0	G6
Et	4, 6-Me ₂	0	G6
Pr	H	0	G6
F	H	0	G6
Cl	H	0	G6
Cl	4-Me	0	G6
Cl	6-Me	0	G6
Cl	4-Et	0	G6
Cl	4-OMe	0	G6
Cl	4-F	0	G6
Cl	4-Cl	0	G6
Cl	4, 6-Me ₂	0	G6
Br	H	0	G6
Br	4-Me	0	G6
Br	6-Me	0	G6
Br	4-Et	0	G6
Br	4-OMe	0	G6

Br	4-F	0	G6
Br	4-Cl	0	G6
Br	4, 6-Me ₂	0	G6
H	H	0	G11
H	3-Me	0	G11
H	4-Me	0	G11
H	5-Me	0	G11
H	6-Me	0	G11
H	4-Et	0	G11
H	4-t-Bu	0	G11
H	4-i-Pr	0	G11
H	4-OMe	0	G11
H	6-OMe	0	G11
H	3-F	0	G11
H	4-F	0	G11
H	5-F	0	G11
H	6-F	0	G11
H	4-Cl	0	G11
H	6-Cl	0	G11
H	4-Br	0	G11
H	4, 6-Me ₂	0	G11
Me	H	0	G11
Me	3-Me	0	G11
Me	4-Me	0	G11
Me	5-Me	0	G11
Me	6-Me	0	G11
Me	4-Et	0	G11
Me	4-t-Bu	0	G11
Me	4-i-Pr	0	G11
Me	4-CF ₃	0	G11
Me	4-OMe	0	G11
Me	6-OMe	0	G11
Me	4-OEt	0	G11
Me	4-SMe	0	G11
Me	4-NMe ₂	0	G11
Me	3-F	0	G11
Me	4-F	0	G11
Me	5-F	0	G11
Me	6-F	0	G11
Me	4-Cl	0	G11
Me	6-Cl	0	G11
Me	4-Br	0	G11
Me	4-I	0	G11
Me	4-CN	0	G11
Me	4, 5-Me ₂	0	G11
Me	4, 6-Me ₂	0	G11
Me	4, 5-(OMe) ₂	0	G11
Et	H	0	G11
Et	4-Me	0	G11
Et	6-Me	0	G11
Et	4-Et	0	G11
Et	4-OMe	0	G11
Et	4-F	0	G11
Et	4-Cl	0	G11
Et	4, 6-Me ₂	0	G11
Pr	H	0	G11
F	H	0	G11
Cl	H	0	G11

C1	4-Me	0	G11
C1	6-Me	0	G11
C1	4-Et	0	G11
C1	4-OMe	0	G11
C1	4-F	0	G11
C1	4-Cl	0	G11
C1	4, 6-Me ₂	0	G11
Br	H	0	G11
Br	4-Me	0	G11
Br	6-Me	0	G11
Br	4-Et	0	G11
Br	4-OMe	0	G11
Br	4-F	0	G11
Br	4-Cl	0	G11
Br	4, 6-Me ₂	0	G11
H	H	0	G12
H	3-Me	0	G12
H	4-Me	0	G12
H	5-Me	0	G12
H	6-Me	0	G12
H	4-Et	0	G12
H	4-t-Bu	0	G12
H	4-i-Pr	0	G12
H	4-OMe	0	G12
H	6-OMe	0	G12
H	3-F	0	G12
H	4-F	0	G12
H	5-F	0	G12
H	6-F	0	G12
H	4-Cl	0	G12
H	6-Cl	0	G12
H	4-Br	0	G12
H	4, 6-Me ₂	0	G12
Me	H	0	G12
Me	3-Me	0	G12
Me	4-Me	0	G12
Me	5-Me	0	G12
Me	6-Me	0	G12
Me	4-Et	0	G12
Me	4-t-Bu	0	G12
Me	4-i-Pr	0	G12
Me	4-CF ₃	0	G12
Me	4-OMe	0	G12
Me	6-OMe	0	G12
Me	4-OEt	0	G12
Me	4-SMe	0	G12
Me	4-NMe ₂	0	G12
Me	3-F	0	G12
Me	4-F	0	G12
Me	5-F	0	G12
Me	6-F	0	G12
Me	4-Cl	0	G12
Me	6-Cl	0	G12
Me	4-Br	0	G12
Me	4-I	0	G12
Me	4-CN	0	G12
Me	4, 5-Me ₂	0	G12
Me	4, 6-Me ₂	0	G12

Me	4, 5-(OMe) ₂	0	G12
Et	H	0	G12
Et	4-Me	0	G12
Et	6-Me	0	G12
Et	4-Et	0	G12
Et	4-OMe	0	G12
Et	4-F	0	G12
Et	4-Cl	0	G12
Et	4, 6-Me ₂	0	G12
Pr	H	0	G12
F	H	0	G12
Cl	H	0	G12
Cl	4-Me	0	G12
Cl	6-Me	0	G12
Cl	4-Et	0	G12
Cl	4-OMe	0	G12
Cl	4-F	0	G12
Cl	4-Cl	0	G12
Cl	4, 6-Me ₂	0	G12
Br	H	0	G12
Br	4-Me	0	G12
Br	6-Me	0	G12
Br	4-Et	0	G12
Br	4-OMe	0	G12
Br	4-F	0	G12
Br	4-Cl	0	G12
Br	4, 6-Me ₂	0	G12
H	H	0	G13
H	3-Me	0	G13
H	4-Me	0	G13
H	5-Me	0	G13
H	6-Me	0	G13
H	4-Et	0	G13
H	4-t-Bu	0	G13
H	4-i-Pr	0	G13
H	4-OMe	0	G13
H	6-OMe	0	G13
H	3-F	0	G13
H	4-F	0	G13
H	5-F	0	G13
H	6-F	0	G13
H	4-Cl	0	G13
H	6-Cl	0	G13
H	4-Br	0	G13
H	4, 6-Me ₂	0	G13
Me	H	0	G13
Me	3-Me	0	G13
Me	4-Me	0	G13
Me	5-Me	0	G13
Me	6-Me	0	G13
Me	4-Et	0	G13
Me	4-t-Bu	0	G13
Me	4-i-Pr	0	G13
Me	4-CF ₃	0	G13
Me	4-OMe	0	G13
Me	6-OMe	0	G13
Me	4-OEt	0	G13
Me	4-SMe	0	G13

Me	4-NMe ₂	0	G13
Me	3-F	0	G13
Me	4-F	0	G13
Me	5-F	0	G13
Me	6-F	0	G13
Me	4-Cl	0	G13
Me	6-Cl	0	G13
Me	4-Br	0	G13
Me	4-I	0	G13
Me	4-CN	0	G13
Me	4, 5-Me ₂	0	G13
Me	4, 6-Me ₂	0	G13
Me	4, 5-(OMe) ₂	0	G13
Et	H	0	G13
Et	4-Me	0	G13
Et	6-Me	0	G13
Et	4-Et	0	G13
Et	4-OMe	0	G13
Et	4-F	0	G13
Et	4-Cl	0	G13
Et	4, 6-Me ₂	0	G13
Pr	H	0	G13
F	H	0	G13
Cl	H	0	G13
Cl	4-Me	0	G13
Cl	6-Me	0	G13
Cl	4-Et	0	G13
Cl	4-OMe	0	G13
Cl	4-F	0	G13
Cl	4-Cl	0	G13
Cl	4, 6-Me ₂	0	G13
Br	H	0	G13
Br	4-Me	0	G13
Br	6-Me	0	G13
Br	4-Et	0	G13
Br	4-OMe	0	G13
Br	4-F	0	G13
Br	4-Cl	0	G13
Br	4, 6-Me ₂	0	G13
H	H	0	G14
H	3-Me	0	G14
H	4-Me	0	G14
H	5-Me	0	G14
H	6-Me	0	G14
H	4-Et	0	G14
H	4-t-Bu	0	G14
H	4-i-Pr	0	G14
H	4-OMe	0	G14
H	6-OMe	0	G14
H	3-F	0	G14
H	4-F	0	G14
H	5-F	0	G14
H	6-F	0	G14
H	4-Cl	0	G14
H	6-Cl	0	G14
H	4-Br	0	G14
H	4, 6-Me ₂	0	G14
Me	H	0	G14

Me	3-Me	0	G14
Me	4-Me	0	G14
Me	5-Me	0	G14
Me	6-Me	0	G14
Me	4-Et	0	G14
Me	4-t-Bu	0	G14
Me	4-i-Pr	0	G14
Me	4-CF ₃	0	G14
Me	4-OMe	0	G14
Me	6-OMe	0	G14
Me	4-OEt	0	G14
Me	4-SMe	0	G14
Me	4-NMe ₂	0	G14
Me	3-F	0	G14
Me	4-F	0	G14
Me	5-F	0	G14
Me	6-F	0	G14
Me	4-Cl	0	G14
Me	6-Cl	0	G14
Me	4-Br	0	G14
Me	4-I	0	G14
Me	4-CN	0	G14
Me	4, 5-Me ₂	0	G14
Me	4, 6-Me ₂	0	G14
Me	4, 5-(OMe) ₂	0	G14
Bt	H	0	G14
Bt	4-Me	0	G14
Bt	6-Me	0	G14
Bt	4-Et	0	G14
Bt	4-OMe	0	G14
Bt	4-F	0	G14
Bt	4-Cl	0	G14
Bt	4, 6-Me ₂	0	G14
Pr	H	0	G14
F	H	0	G14
C1	H	0	G14
C1	4-Me	0	G14
C1	6-Me	0	G14
C1	4-Et	0	G14
C1	4-OMe	0	G14
C1	4-F	0	G14
C1	4-Cl	0	G14
C1	4, 6-Me ₂	0	G14
Br	H	0	G14
Br	4-Me	0	G14
Br	6-Me	0	G14
Br	4-Et	0	G14
Br	4-OMe	0	G14
Br	4-F	0	G14
Br	4-Cl	0	G14
Br	4, 6-Me ₂	0	G14
H	H	0	G15
H	3-Me	0	G15
H	4-Me	0	G15
H	5-Me	0	G15
H	6-Me	0	G15
H	4-Et	0	G15
H	4-t-Bu	0	G15

H	4-i-Pr	0	G15
H	4-OMe	0	G15
H	6-OMe	0	G15
H	3-F	0	G15
H	4-F	0	G15
H	5-F	0	G15
H	6-F	0	G15
H	4-Cl	0	G15
H	6-Cl	0	G15
H	4-Br	0	G15
H	4, 6-Me ₂	0	G15
Me	H	0	G15
Me	3-Me	0	G15
Me	4-Me	0	G15
Me	5-Me	0	G15
Me	6-Me	0	G15
Me	4-Et	0	G15
Me	4-t-Bu	0	G15
Me	4-i-Pr	0	G15
Me	4-CF ₃	0	G15
Me	4-OMe	0	G15
Me	6-OMe	0	G15
Me	4-OEt	0	G15
Me	4-SMe	0	G15
Me	4-NMe ₂	0	G15
Me	3-F	0	G15
Me	4-F	0	G15
Me	5-F	0	G15
Me	6-F	0	G15
Me	4-Cl	0	G15
Me	6-Cl	0	G15
Me	4-Br	0	G15
Me	4-I	0	G15
Me	4-CN	0	G15
Me	4, 5-Me ₂	0	G15
Me	4, 6-Me ₂	0	G15
Me	4, 5-(OMe) ₂	0	G15
Et	H	0	G15
Et	4-Me	0	G15
Et	6-Me	0	G15
Et	4-Et	0	G15
Et	4-OMe	0	G15
Et	4-F	0	G15
Et	4-Cl	0	G15
Et	4, 6-Me ₂	0	G15
Pr	H	0	G15
F	H	0	G15
Cl	H	0	G15
Cl	4-Me	0	G15
Cl	6-Me	0	G15
Cl	4-Et	0	G15
Cl	4-OMe	0	G15
Cl	4-F	0	G15
Cl	4-Cl	0	G15
Cl	4, 6-Me ₂	0	G15
Br	H	0	G15
Br	4-Me	0	G15
Br	6-Me	0	G15

Br	4-Et	0	G15
Br	4-OMe	0	G15
Br	4-F	0	G15
Br	4-Cl	0	G15
Br	4, 6-Me ₂	0	G15
H	H	0	G16
H	3-Me	0	G16
H	4-Me	0	G16
H	5-Me	0	G16
H	6-Me	0	G16
H	4-Et	0	G16
H	4-t-Bu	0	G16
H	4-i-Pr	0	G16
H	4-OMe	0	G16
H	6-OMe	0	G16
H	3-F	0	G16
H	4-F	0	G16
H	5-F	0	G16
H	6-F	0	G16
H	4-Cl	0	G16
H	6-Cl	0	G16
H	4-Br	0	G16
H	4, 6-Me ₂	0	G16
Me	H	0	G16
Me	3-Me	0	G16
Me	4-Me	0	G16
Me	5-Me	0	G16
Me	6-Me	0	G16
Me	4-Et	0	G16
Me	4-t-Bu	0	G16
Me	4-i-Pr	0	G16
Me	4-CF ₃	0	G16
Me	4-OMe	0	G16
Me	6-OMe	0	G16
Me	4-OEt	0	G16
Me	4-SMe	0	G16
Me	4-NMe ₂	0	G16
Me	3-F	0	G16
Me	4-F	0	G16
Me	5-F	0	G16
Me	6-F	0	G16
Me	4-Cl	0	G16
Me	6-Cl	0	G16
Me	4-Br	0	G16
Me	4-I	0	G16
Me	4-CN	0	G16
Me	4, 5-Me ₂	0	G16
Me	4, 6-Me ₂	0	G16
Me	4, 5-(OMe) ₂	0	G16
Et	H	0	G16
Et	4-Me	0	G16
Et	6-Me	0	G16
Et	4-Et	0	G16
Et	4-OMe	0	G16
Et	4-F	0	G16
Et	4-Cl	0	G16
Et	4, 6-Me ₂	0	G16
Pr	H	0	G16

F	H	0	G16
C1	H	0	G16
C1	4-Me	0	G16
C1	6-Me	0	G16
C1	4-Et	0	G16
C1	4-OMe	0	G16
C1	4-F	0	G16
C1	4-Cl	0	G16
C1	4, 6-Me ₂	0	G16
Br	H	0	G16
Br	4-Me	0	G16
Br	6-Me	0	G16
Br	4-Et	0	G16
Br	4-OMe	0	G16
Br	4-F	0	G16
Br	4-Cl	0	G16
Br	4, 6-Me ₂	0	G16
H	H	0	G17
H	3-Me	0	G17
H	4-Me	0	G17
H	5-Me	0	G17
H	6-Me	0	G17
H	4-Et	0	G17
H	4-t-Bu	0	G17
H	4-i-Pr	0	G17
H	4-OMe	0	G17
H	6-OMe	0	G17
H	3-F	0	G17
H	4-F	0	G17
H	5-F	0	G17
H	6-F	0	G17
H	4-Cl	0	G17
H	6-Cl	0	G17
H	4-Br	0	G17
H	4, 6-Me ₂	0	G17
Me	H	0	G17
Me	3-Me	0	G17
Me	4-Me	0	G17
Me	5-Me	0	G17
Me	6-Me	0	G17
Me	4-Et	0	G17
Me	4-t-Bu	0	G17
Me	4-i-Pr	0	G17
Me	4-CF ₃	0	G17
Me	4-OMe	0	G17
Me	6-OMe	0	G17
Me	4-OEt	0	G17
Me	4-SMe	0	G17
Me	4-NMe ₂	0	G17
Me	3-F	0	G17
Me	4-F	0	G17
Me	5-F	0	G17
Me	6-F	0	G17
Me	4-Cl	0	G17
Me	6-Cl	0	G17
Me	4-Br	0	G17
Me	4-I	0	G17
Me	4-CN	0	G17

Me	4, 5-Me ₂	O	G17
Me	4, 6-Me ₂	O	G17
Me	4, 5-(OMe) ₂	O	G17
Et	H	O	G17
Et	4-Me	O	G17
Et	6-Me	O	G17
Et	4-Et	O	G17
Et	4-OMe	O	G17
Et	4-F	O	G17
Et	4-Cl	O	G17
Et	4, 6-Me ₂	O	G17
Pr	H	O	G17
F	H	O	G17
Cl	H	O	G17
Cl	4-Me	O	G17
Cl	6-Me	O	G17
Cl	4-Et	O	G17
Cl	4-OMe	O	G17
Cl	4-F	O	G17
Cl	4-Cl	O	G17
Cl	4, 6-Me ₂	O	G17
Br	H	O	G17
Br	4-Me	O	G17
Br	6-Me	O	G17
Br	4-Et	O	G17
Br	4-OMe	O	G17
Br	4-F	O	G17
Br	4-Cl	O	G17
Br	4, 6-Me ₂	O	G17
H	H	S	G1
H	3-Me	S	G1
H	4-Me	S	G1
H	5-Me	S	G1
H	6-Me	S	G1
H	4-Et	S	G1
H	4-t-Bu	S	G1
H	4-i-Pr	S	G1
H	4-OMe	S	G1
H	6-OMe	S	G1
H	3-F	S	G1
H	4-F	S	G1
H	5-F	S	G1
H	6-F	S	G1
H	4-Cl	S	G1
H	6-Cl	S	G1
H	4-Br	S	G1
H	4, 6-Me ₂	S	G1
Me	H	S	G1
Me	3-Me	S	G1
Me	4-Me	S	G1
Me	5-Me	S	G1
Me	6-Me	S	G1
Me	4-Et	S	G1
Me	4-t-Bu	S	G1
Me	4-i-Pr	S	G1
Me	4-CF ₃	S	G1
Me	4-OMe	S	G1
Me	6-OMe	S	G1

Me	4-OEt	S	G1
Me	4-SMe	S	G1
Me	4-NMe ₂	S	G1
Me	3-F	S	G1
Me	4-F	S	G1
Me	5-F	S	G1
Me	6-F	S	G1
Me	4-Cl	S	G1
Me	6-Cl	S	G1
Me	4-Br	S	G1
Me	4-I	S	G1
Me	4-CN	S	G1
Me	4, 5-Me ₂	S	G1
Me	4, 6-Me ₂	S	G1
Me	4, 5-(OMe) ₂	S	G1
Et	H	S	G1
Et	4-Me	S	G1
Et	6-Me	S	G1
Et	4-Et	S	G1
Et	4-OMe	S	G1
Et	4-F	S	G1
Et	4-Cl	S	G1
Et	4, 6-Me ₂	S	G1
Pr	H	S	G1
F	H	S	G1
Cl	H	S	G1
Cl	4-Me	S	G1
Cl	6-Me	S	G1
Cl	4-Et	S	G1
Cl	4-OMe	S	G1
Cl	4-F	S	G1
Cl	4-Cl	S	G1
Cl	4, 6-Me ₂	S	G1
Br	H	S	G1
Br	4-Me	S	G1
Br	6-Me	S	G1
Br	4-Et	S	G1
Br	4-OMe	S	G1
Br	4-F	S	G1
Br	4-Cl	S	G1
Br	4, 6-Me ₂	S	G1
H	H	S	G2
H	3-Me	S	G2
H	4-Me	S	G2
H	5-Me	S	G2
H	6-Me	S	G2
H	4-Et	S	G2
H	4-t-Bu	S	G2
H	4-i-Pr	S	G2
H	4-OMe	S	G2
H	6-OMe	S	G2
H	3-F	S	G2
H	4-F	S	G2
H	5-F	S	G2
H	6-F	S	G2
H	4-Cl	S	G2
H	6-Cl	S	G2
H	4-Br	S	G2

H	4, 6-Me ₂	S	G2
Me	H	S	G2
Me	3-Me	S	G2
Me	4-Me	S	G2
Me	5-Me	S	G2
Me	6-Me	S	G2
Me	4-Et	S	G2
Me	4-t-Bu	S	G2
Me	4-i-Pr	S	G2
Me	4-CF ₃	S	G2
Me	4-OMe	S	G2
Me	6-OMe	S	G2
Me	4-OEt	S	G2
Me	4-SMe	S	G2
Me	4-NMe ₂	S	G2
Me	3-F	S	G2
Me	4-F	S	G2
Me	5-F	S	G2
Me	6-F	S	G2
Me	4-Cl	S	G2
Me	6-Cl	S	G2
Me	4-Br	S	G2
Me	4-I	S	G2
Me	4-CN	S	G2
Me	4, 5-Me ₂	S	G2
Me	4, 6-Me ₂	S	G2
Me	4, 5-(OMe) ₂	S	G2
Et	H	S	G2
Et	4-Me	S	G2
Et	6-Me	S	G2
Et	4-Et	S	G2
Et	4-OMe	S	G2
Et	4-F	S	G2
Et	4-Cl	S	G2
Et	4, 6-Me ₂	S	G2
Pr	H	S	G2
F	H	S	G2
Cl	H	S	G2
Cl	4-Me	S	G2
Cl	6-Me	S	G2
Cl	4-Et	S	G2
Cl	4-OMe	S	G2
Cl	4-F	S	G2
Cl	4-Cl	S	G2
Cl	4, 6-Me ₂	S	G2
Br	H	S	G2
Br	4-Me	S	G2
Br	6-Me	S	G2
Br	4-Et	S	G2
Br	4-OMe	S	G2
Br	4-F	S	G2
Br	4-Cl	S	G2
Br	4, 6-Me ₂	S	G2
H	H	S	G4
H	3-Me	S	G4
H	4-Me	S	G4
H	5-Me	S	G4
H	6-Me	S	G4

H	4-Et	S	G4
H	4-t-Bu	S	G4
H	4-i-Pr	S	G4
H	4-OMe	S	G4
H	6-OMe	S	G4
H	3-F	S	G4
H	4-F	S	G4
H	5-F	S	G4
H	6-F	S	G4
H	4-Cl	S	G4
H	6-Cl	S	G4
H	4-Br	S	G4
H	4, 6-Me ₂	S	G4
Me	H	S	G4
Me	3-Me	S	G4
Me	4-Me	S	G4
Me	5-Me	S	G4
Me	6-Me	S	G4
Me	4-Et	S	G4
Me	4-t-Bu	S	G4
Me	4-i-Pr	S	G4
Me	4-CF ₃	S	G4
Me	4-OMe	S	G4
Me	6-OMe	S	G4
Me	4-OEt	S	G4
Me	4-SMe	S	G4
Me	4-NMe ₂	S	G4
Me	3-F	S	G4
Me	4-F	S	G4
Me	5-F	S	G4
Me	6-F	S	G4
Me	4-Cl	S	G4
Me	6-Cl	S	G4
Me	4-Br	S	G4
Me	4-I	S	G4
Me	4-CN	S	G4
Me	4, 5-Me ₂	S	G4
Me	4, 6-Me ₂	S	G4
Me	4, 5-(OMe) ₂	S	G4
Et	H	S	G4
Et	4-Me	S	G4
Et	6-Me	S	G4
Et	4-Et	S	G4
Et	4-OMe	S	G4
Et	4-F	S	G4
Et	4-Cl	S	G4
Et	4, 6-Me ₂	S	G4
Pr	H	S	G4
F	H	S	G4
Cl	H	S	G4
Cl	4-Me	S	G4
Cl	6-Me	S	G4
Cl	4-Et	S	G4
Cl	4-OMe	S	G4
Cl	4-F	S	G4
Cl	4-Cl	S	G4
Cl	4, 6-Me ₂	S	G4
Br	H	S	G4

Br	4-Me	S	G4
Br	6-Me	S	G4
Br	4-Et	S	G4
Br	4-OMe	S	G4
Br	4-F	S	G4
Br	4-Cl	S	G4
Br	4, 6-Me ₂	S	G4
H	H	S	G5
H	3-Me	S	G5
H	4-Me	S	G5
H	5-Me	S	G5
H	6-Me	S	G5
H	4-Et	S	G5
H	4-t-Bu	S	G5
H	4-i-Pr	S	G5
H	4-OMe	S	G5
H	6-OMe	S	G5
H	3-F	S	G5
H	4-F	S	G5
H	5-F	S	G5
H	6-F	S	G5
H	4-Cl	S	G5
H	6-Cl	S	G5
H	4-Br	S	G5
H	4, 6-Me ₂	S	G5
Me	H	S	G5
Me	3-Me	S	G5
Me	4-Me	S	G5
Me	5-Me	S	G5
Me	6-Me	S	G5
Me	4-Et	S	G5
Me	4-t-Bu	S	G5
Me	4-i-Pr	S	G5
Me	4-CF ₃	S	G5
Me	4-OMe	S	G5
Me	6-OMe	S	G5
Me	4-OEt	S	G5
Me	4-SMe	S	G5
Me	4-NMe ₂	S	G5
Me	3-F	S	G5
Me	4-F	S	G5
Me	5-F	S	G5
Me	6-F	S	G5
Me	4-Cl	S	G5
Me	6-Cl	S	G5
Me	4-Br	S	G5
Me	4-I	S	G5
Me	4-CN	S	G5
Me	4, 5-Me ₂	S	G5
Me	4, 6-Me ₂	S	G5
Me	4, 5-(OMe) ₂	S	G5
Et	H	S	G5
Et	4-Me	S	G5
Et	6-Me	S	G5
Et	4-Et	S	G5
Et	4-OMe	S	G5
Et	4-F	S	G5
Et	4-Cl	S	G5

Et	4, 6-Me ₂	S	G5
Pr	H	S	G5
F	H	S	G5
Cl	H	S	G5
Cl	4-Me	S	G5
Cl	6-Me	S	G5
Cl	4-Et	S	G5
Cl	4-OMe	S	G5
Cl	4-F	S	G5
Cl	4-Cl	S	G5
Cl	4, 6-Me ₂	S	G5
Br	H	S	G5
Br	4-Me	S	G5
Br	6-Me	S	G5
Br	4-Et	S	G5
Br	4-OMe	S	G5
Br	4-F	S	G5
Br	4-Cl	S	G5
Br	4, 6-Me ₂	S	G5
H	H	S	G6
H	3-Me	S	G6
H	4-Me	S	G6
H	5-Me	S	G6
H	6-Me	S	G6
H	4-Et	S	G6
H	4-t-Bu	S	G6
H	4-i-Pr	S	G6
H	4-OMe	S	G6
H	6-OMe	S	G6
H	3-F	S	G6
H	4-F	S	G6
H	5-F	S	G6
H	6-F	S	G6
H	4-Cl	S	G6
H	6-Cl	S	G6
H	4-Br	S	G6
H	4, 6-Me ₂	S	G6
Me	H	S	G6
Me	3-Me	S	G6
Me	4-Me	S	G6
Me	5-Me	S	G6
Me	6-Me	S	G6
Me	4-Et	S	G6
Me	4-t-Bu	S	G6
Me	4-i-Pr	S	G6
Me	4-CF ₃	S	G6
Me	4-OMe	S	G6
Me	6-OMe	S	G6
Me	4-OEt	S	G6
Me	4-SMe	S	G6
Me	4-NMe ₂	S	G6
Me	3-F	S	G6
Me	4-F	S	G6
Me	5-F	S	G6
Me	6-F	S	G6
Me	4-Cl	S	G6
Me	6-Cl	S	G6
Me	4-Br	S	G6

Me	4-I	S	G6
Me	4-CN	S	G6
Me	4, 5-Me ₂	S	G6
Me	4, 6-Me ₂	S	G6
Me	4, 5-(OMe) ₂	S	G6
Et	H	S	G6
Et	4-Me	S	G6
Et	6-Me	S	G6
Et	4-Et	S	G6
Et	4-OMe	S	G6
Bt	4-F	S	G6
Bt	4-Cl	S	G6
Bt	4, 6-Me ₂	S	G6
Pr	H	S	G6
F	H	S	G6
Cl	H	S	G6
Cl	4-Me	S	G6
Cl	6-Me	S	G6
Cl	4-Et	S	G6
Cl	4-OMe	S	G6
Cl	4-F	S	G6
Cl	4-Cl	S	G6
Cl	4, 6-Me ₂	S	G6
Br	H	S	G6
Br	4-Me	S	G6
Br	6-Me	S	G6
Br	4-Et	S	G6
Br	4-OMe	S	G6
Br	4-F	S	G6
Br	4-Cl	S	G6
Br	4, 6-Me ₂	S	G6
H	H	S	G11
H	3-Me	S	G11
H	4-Me	S	G11
H	5-Me	S	G11
H	6-Me	S	G11
H	4-Et	S	G11
H	4-t-Bu	S	G11
H	4-i-Pr	S	G11
H	4-OMe	S	G11
H	6-OMe	S	G11
H	3-F	S	G11
H	4-F	S	G11
H	5-F	S	G11
H	6-F	S	G11
H	4-Cl	S	G11
H	6-Cl	S	G11
H	4-Br	S	G11
H	4, 6-Me ₂	S	G11
Me	H	S	G11
Me	3-Me	S	G11
Me	4-Me	S	G11
Me	5-Me	S	G11
Me	6-Me	S	G11
Me	4-Et	S	G11
Me	4-t-Bu	S	G11
Me	4-i-Pr	S	G11
Me	4-CF ₃	S	G11

Me	4-OMe	S	G11
Me	6-OMe	S	G11
Me	4-OEt	S	G11
Me	4-SMe	S	G11
Me	4-NMe ₂	S	G11
Me	3-F	S	G11
Me	4-F	S	G11
Me	5-F	S	G11
Me	6-F	S	G11
Me	4-Cl	S	G11
Me	6-Cl	S	G11
Me	4-Br	S	G11
Me	4-I	S	G11
Me	4-CN	S	G11
Me	4, 5-Me ₂	S	G11
Me	4, 6-Me ₂	S	G11
Me	4, 5-(OMe) ₂	S	G11
Et	H	S	G11
Et	4-Me	S	G11
Et	6-Me	S	G11
Et	4-Et	S	G11
Et	4-OMe	S	G11
Et	4-F	S	G11
Et	4-Cl	S	G11
Et	4, 6-Me ₂	S	G11
Pr	H	S	G11
F	H	S	G11
Cl	H	S	G11
Cl	4-Me	S	G11
Cl	6-Me	S	G11
Cl	4-Et	S	G11
Cl	4-OMe	S	G11
Cl	4-F	S	G11
Cl	4-Cl	S	G11
Cl	4, 6-Me ₂	S	G11
Br	H	S	G11
Br	4-Me	S	G11
Br	6-Me	S	G11
Br	4-Et	S	G11
Br	4-OMe	S	G11
Br	4-F	S	G11
Br	4-Cl	S	G11
Br	4, 6-Me ₂	S	G11
H	H	S	G12
H	3-Me	S	G12
H	4-Me	S	G12
H	5-Me	S	G12
H	6-Me	S	G12
H	4-Et	S	G12
H	4-t-Bu	S	G12
H	4-i-Pr	S	G12
H	4-OMe	S	G12
H	6-OMe	S	G12
H	3-F	S	G12
H	4-F	S	G12
H	5-F	S	G12
H	6-F	S	G12
H	4-Cl	S	G12

H	6-Cl	S	G12
H	4-Br	S	G12
H	4, 6-Me ₂	S	G12
Me	H	S	G12
Me	3-Me	S	G12
Me	4-Me	S	G12
Me	5-Me	S	G12
Me	6-Me	S	G12
Me	4-Et	S	G12
Me	4-t-Bu	S	G12
Me	4-i-Pr	S	G12
Me	4-CF ₃	S	G12
Me	4-OMe	S	G12
Me	6-OMe	S	G12
Me	4-OEt	S	G12
Me	4-SMe	S	G12
Me	4-NMe ₂	S	G12
Me	3-F	S	G12
Me	4-F	S	G12
Me	5-F	S	G12
Me	6-F	S	G12
Me	4-Cl	S	G12
Me	6-Cl	S	G12
Me	4-Br	S	G12
Me	4-I	S	G12
Me	4-CN	S	G12
Me	4, 5-Me ₂	S	G12
Me	4, 6-Me ₂	S	G12
Me	4, 5-(OMe) ₂	S	G12
Et	H	S	G12
Et	4-Me	S	G12
Et	6-Me	S	G12
Et	4-Et	S	G12
Et	4-OMe	S	G12
Et	4-F	S	G12
Et	4-Cl	S	G12
Et	4, 6-Me ₂	S	G12
Pr	H	S	G12
F	H	S	G12
Cl	H	S	G12
Cl	4-Me	S	G12
Cl	6-Me	S	G12
Cl	4-Et	S	G12
Cl	4-OMe	S	G12
Cl	4-F	S	G12
Cl	4-Cl	S	G12
Cl	4, 6-Me ₂	S	G12
Br	H	S	G12
Br	4-Me	S	G12
Br	6-Me	S	G12
Br	4-Et	S	G12
Br	4-OMe	S	G12
Br	4-F	S	G12
Br	4-Cl	S	G12
Br	4, 6-Me ₂	S	G12
H	H	S	G13
H	3-Me	S	G13
H	4-Me	S	G13

H	5-Me	S	G13
H	6-Me	S	G13
H	4-Et	S	G13
H	4-t-Bu	S	G13
H	4-i-Pr	S	G13
H	4-OMe	S	G13
H	6-OMe	S	G13
H	3-F	S	G13
H	4-F	S	G13
H	5-F	S	G13
H	6-F	S	G13
H	4-Cl	S	G13
H	6-Cl	S	G13
H	4-Br	S	G13
H	4, 6-Me ₂	S	G13
Me	H	S	G13
Me	3-Me	S	G13
Me	4-Me	S	G13
Me	5-Me	S	G13
Me	6-Me	S	G13
Me	4-Et	S	G13
Me	4-t-Bu	S	G13
Me	4-i-Pr	S	G13
Me	4-CF ₃	S	G13
Me	4-OMe	S	G13
Me	6-OMe	S	G13
Me	4-OEt	S	G13
Me	4-SMe	S	G13
Me	4-NMe ₂	S	G13
Me	3-F	S	G13
Me	4-F	S	G13
Me	5-F	S	G13
Me	6-F	S	G13
Me	4-Cl	S	G13
Me	6-Cl	S	G13
Me	4-Br	S	G13
Me	4-I	S	G13
Me	4-CN	S	G13
Me	4, 5-Me ₂	S	G13
Me	4, 6-Me ₂	S	G13
Me	4, 5-(OMe) ₂	S	G13
Et	H	S	G13
Et	4-Me	S	G13
Et	6-Me	S	G13
Et	4-Et	S	G13
Et	4-OMe	S	G13
Et	4-F	S	G13
Et	4-Cl	S	G13
Et	4, 6-Me ₂	S	G13
Pr	H	S	G13
F	H	S	G13
C1	H	S	G13
C1	4-Me	S	G13
C1	6-Me	S	G13
C1	4-Et	S	G13
C1	4-OMe	S	G13
C1	4-F	S	G13
C1	4-Cl	S	G13

Cl	4, 6-Me ₂	S	G13
Br	H	S	G13
Br	4-Me	S	G13
Br	6-Me	S	G13
Br	4-Et	S	G13
Br	4-OMe	S	G13
Br	4-F	S	G13
Br	4-Cl	S	G13
Br	4, 6-Me ₂	S	G13
H	H	S	G14
H	3-Me	S	G14
H	4-Me	S	G14
H	5-Me	S	G14
H	6-Me	S	G14
H	4-Et	S	G14
H	4-t-Bu	S	G14
H	4-i-Pr	S	G14
H	4-OMe	S	G14
H	6-OMe	S	G14
H	3-F	S	G14
H	4-F	S	G14
H	5-F	S	G14
H	6-F	S	G14
H	4-Cl	S	G14
H	6-Cl	S	G14
H	4-Br	S	G14
H	4, 6-Me ₂	S	G14
Me	H	S	G14
Me	3-Me	S	G14
Me	4-Me	S	G14
Me	5-Me	S	G14
Me	6-Me	S	G14
Me	4-Et	S	G14
Me	4-t-Bu	S	G14
Me	4-i-Pr	S	G14
Me	4-CF ₃	S	G14
Me	4-OMe	S	G14
Me	6-OMe	S	G14
Me	4-OEt	S	G14
Me	4-SMe	S	G14
Me	4-NMe ₂	S	G14
Me	3-F	S	G14
Me	4-F	S	G14
Me	5-F	S	G14
Me	6-F	S	G14
Me	4-Cl	S	G14
Me	6-Cl	S	G14
Me	4-Br	S	G14
Me	4-I	S	G14
Me	4-CN	S	G14
Me	4, 5-Me ₂	S	G14
Me	4, 6-Me ₂	S	G14
Me	4, 5-(OMe) ₂	S	G14
Et	H	S	G14
Et	4-Me	S	G14
Et	6-Me	S	G14
Et	4-Et	S	G14
Et	4-OMe	S	G14

Et	4-F	S	G14
Et	4-Cl	S	G14
Et	4, 6-Me ₂	S	G14
Pr	H	S	G14
F	H	S	G14
Cl	H	S	G14
Cl	4-Me	S	G14
Cl	6-Me	S	G14
Cl	4-Et	S	G14
Cl	4-OMe	S	G14
Cl	4-F	S	G14
Cl	4-Cl	S	G14
Cl	4, 6-Me ₂	S	G14
Br	H	S	G14
Br	4-Me	S	G14
Br	6-Me	S	G14
Br	4-Et	S	G14
Br	4-OMe	S	G14
Br	4-F	S	G14
Br	4-Cl	S	G14
Br	4, 6-Me ₂	S	G14
H	H	S	G15
H	3-Me	S	G15
H	4-Me	S	G15
H	5-Me	S	G15
H	6-Me	S	G15
H	4-Et	S	G15
H	4-t-Bu	S	G15
H	4-i-Pr	S	G15
H	4-OMe	S	G15
H	6-OMe	S	G15
H	3-F	S	G15
H	4-F	S	G15
H	5-F	S	G15
H	6-F	S	G15
H	4-Cl	S	G15
H	6-Cl	S	G15
H	4-Br	S	G15
H	4, 6-Me ₂	S	G15
Me	H	S	G15
Me	3-Me	S	G15
Me	4-Me	S	G15
Me	5-Me	S	G15
Me	6-Me	S	G15
Me	4-Et	S	G15
Me	4-t-Bu	S	G15
Me	4-i-Pr	S	G15
Me	4-CF ₃	S	G15
Me	4-OMe	S	G15
Me	6-OMe	S	G15
Me	4-OEt	S	G15
Me	4-SMe	S	G15
Me	4-NMe ₂	S	G15
Me	3-F	S	G15
Me	4-F	S	G15
Me	5-F	S	G15
Me	6-F	S	G15
Me	4-Cl	S	G15

Me	6-Cl	S	G15
Me	4-Br	S	G15
Me	4-I	S	G15
Me	4-CN	S	G15
Me	4, 5-Me ₂	S	G15
Me	4, 6-Me ₂	S	G15
Me	4, 5-(OMe) ₂	S	G15
Et	H	S	G15
Et	4-Me	S	G15
Et	6-Me	S	G15
Et	4-Et	S	G15
Et	4-OMe	S	G15
Et	4-F	S	G15
Et	4-Cl	S	G15
Et	4, 6-Me ₂	S	G15
Pr	H	S	G15
F	H	S	G15
Cl	H	S	G15
Cl	4-Me	S	G15
Cl	6-Me	S	G15
Cl	4-Et	S	G15
Cl	4-OMe	S	G15
Cl	4-F	S	G15
Cl	4-Cl	S	G15
Cl	4, 6-Me ₂	S	G15
Br	H	S	G15
Br	4-Me	S	G15
Br	6-Me	S	G15
Br	4-Et	S	G15
Br	4-OMe	S	G15
Br	4-F	S	G15
Br	4-Cl	S	G15
Br	4, 6-Me ₂	S	G15
H	H	S	G16
H	3-Me	S	G16
H	4-Me	S	G16
H	5-Me	S	G16
H	6-Me	S	G16
H	4-Et	S	G16
H	4-t-Bu	S	G16
H	4-i-Pr	S	G16
H	4-OMe	S	G16
H	6-OMe	S	G16
H	3-F	S	G16
H	4-F	S	G16
H	5-F	S	G16
H	6-F	S	G16
H	4-Cl	S	G16
H	6-Cl	S	G16
H	4-Br	S	G16
H	4, 6-Me ₂	S	G16
Me	H	S	G16
Me	3-Me	S	G16
Me	4-Me	S	G16
Me	5-Me	S	G16
Me	6-Me	S	G16
Me	4-Et	S	G16
Me	4-t-Bu	S	G16

Me	4-i-Pr	S	G16
Me	4-CF ₃	S	G16
Me	4-OMe	S	G16
Me	6-OMe	S	G16
Me	4-OEt	S	G16
Me	4-SMe	S	G16
Me	4-NMe ₂	S	G16
Me	3-F	S	G16
Me	4-F	S	G16
Me	5-F	S	G16
Me	6-F	S	G16
Me	4-Cl	S	G16
Me	6-Cl	S	G16
Me	4-Br	S	G16
Me	4-I	S	G16
Me	4-CN	S	G16
Me	4, 5-Me ₂	S	G16
Me	4, 6-Me ₂	S	G16
Me	4, 5-(OMe) ₂	S	G16
Et	H	S	G16
Et	4-Me	S	G16
Et	6-Me	S	G16
Et	4-Et	S	G16
Et	4-OMe	S	G16
Et	4-F	S	G16
Et	4-Cl	S	G16
Et	4, 6-Me ₂	S	G16
Pr	H	S	G16
F	H	S	G16
Cl	H	S	G16
Cl	4-Me	S	G16
Cl	6-Me	S	G16
Cl	4-Bt	S	G16
Cl	4-OMe	S	G16
Cl	4-F	S	G16
Cl	4-Cl	S	G16
Cl	4, 6-Me ₂	S	G16
Br	H	S	G16
Br	4-Me	S	G16
Br	6-Me	S	G16
Br	4-Et	S	G16
Br	4-OMe	S	G16
Br	4-F	S	G16
Br	4-Cl	S	G16
Br	4, 6-Me ₂	S	G16
H	H	S	G17
H	3-Me	S	G17
H	4-Me	S	G17
H	5-Me	S	G17
H	6-Me	S	G17
H	4-Et	S	G17
H	4-t-Bu	S	G17
H	4-i-Pr	S	G17
H	4-OMe	S	G17
H	6-OMe	S	G17
H	3-F	S	G17
H	4-F	S	G17
H	5-F	S	G17

H	6-F	S	G17
H	4-Cl	S	G17
H	6-Cl	S	G17
H	4-Br	S	G17
H	4, 6-Me ₂	S	G17
Me	H	S	G17
Me	3-Me	S	G17
Me	4-Me	S	G17
Me	5-Me	S	G17
Me	6-Me	S	G17
Me	4-Et	S	G17
Me	4-t-Bu	S	G17
Me	4-i-Pr	S	G17
Me	4-CF ₃	S	G17
Me	4-OMe	S	G17
Me	6-OMe	S	G17
Me	4-OEt	S	G17
Me	4-SMe	S	G17
Me	4-NMe ₂	S	G17
Me	3-F	S	G17
Me	4-F	S	G17
Me	5-F	S	G17
Me	6-F	S	G17
Me	4-Cl	S	G17
Me	6-Cl	S	G17
Me	4-Br	S	G17
Me	4-I	S	G17
Me	4-CN	S	G17
Me	4, 5-Me ₂	S	G17
Me	4, 6-Me ₂	S	G17
Me	4, 5-(OMe) ₂	S	G17
Et	H	S	G17
Et	4-Me	S	G17
Et	6-Me	S	G17
Et	4-Et	S	G17
Et	4-OMe	S	G17
Et	4-F	S	G17
Et	4-Cl	S	G17
Et	4, 6-Me ₂	S	G17
Pr	H	S	G17
F	H	S	G17
Cl	H	S	G17
Cl	4-Me	S	G17
Cl	6-Me	S	G17
Cl	4-Et	S	G17
Cl	4-OMe	S	G17
Cl	4-F	S	G17
Cl	4-Cl	S	G17
Cl	4, 6-Me ₂	S	G17
Br	H	S	G17
Br	4-Me	S	G17
Br	6-Me	S	G17
Br	4-Et	S	G17
Br	4-OMe	S	G17
Br	4-F	S	G17
Br	4-Cl	S	G17
Br	4, 6-Me ₂	S	G17
H	H	N-Me	G1

H	3-Me	N-Me	G1
H	4-Me	N-Me	G1
H	5-Me	N-Me	G1
H	6-Me	N-Me	G1
H	4-Et	N-Me	G1
H	4-t-Bu	N-Me	G1
H	4-i-Pr	N-Me	G1
H	4-OMe	N-Me	G1
H	6-OMe	N-Me	G1
H	3-F	N-Me	G1
H	4-F	N-Me	G1
H	5-F	N-Me	G1
H	6-F	N-Me	G1
H	4-Cl	N-Me	G1
H	6-Cl	N-Me	G1
H	4-Br	N-Me	G1
H	4, 6-Me ₂	N-Me	G1
Me	H	N-Me	G1
Me	3-Me	N-Me	G1
Me	4-Me	N-Me	G1
Me	5-Me	N-Me	G1
Me	6-Me	N-Me	G1
Me	4-Et	N-Me	G1
Me	4-t-Bu	N-Me	G1
Me	4-i-Pr	N-Me	G1
Me	4-CF ₃	N-Me	G1
Me	4-OMe	N-Me	G1
Me	6-OMe	N-Me	G1
Me	4-OEt	N-Me	G1
Me	4-SMe	N-Me	G1
Me	4-NMe ₂	N-Me	G1
Me	3-F	N-Me	G1
Me	4-F	N-Me	G1
Me	5-F	N-Me	G1
Me	6-F	N-Me	G1
Me	4-Cl	N-Me	G1
Me	6-Cl	N-Me	G1
Me	4-Br	N-Me	G1
Me	4-I	N-Me	G1
Me	4-CN	N-Me	G1
Me	4, 5-Me ₂	N-Me	G1
Me	4, 6-Me ₂	N-Me	G1
Me	4, 5-(OMe) ₂	N-Me	G1
Et	H	N-Me	G1
Et	4-Me	N-Me	G1
Et	6-Me	N-Me	G1
Et	4-Et	N-Me	G1
Et	4-OMe	N-Me	G1
Et	4-F	N-Me	G1
Et	4-Cl	N-Me	G1
Et	4, 6-Me ₂	N-Me	G1
Pr	H	N-Me	G1
F	H	N-Me	G1
Cl	H	N-Me	G1
Cl	4-Me	N-Me	G1
Cl	6-Me	N-Me	G1
Cl	4-Et	N-Me	G1
Cl	4-OMe	N-Me	G1

C1	4-F	N-Me	G1
C1	4-Cl	N-Me	G1
C1	4, 6-Me ₂	N-Me	G1
Br	H	N-Me	G1
Br	4-Me	N-Me	G1
Br	6-Me	N-Me	G1
Br	4-Et	N-Me	G1
Br	4-OMe	N-Me	G1
Br	4-F	N-Me	G1
Br	4-Cl	N-Me	G1
Br	4, 6-Me ₂	N-Me	G1
H	H	N-Me	G2
H	3-Me	N-Me	G2
H	4-Me	N-Me	G2
H	5-Me	N-Me	G2
H	6-Me	N-Me	G2
H	4-Et	N-Me	G2
H	4-t-Bu	N-Me	G2
H	4-i-Pr	N-Me	G2
H	4-OMe	N-Me	G2
H	6-OMe	N-Me	G2
H	3-F	N-Me	G2
H	4-F	N-Me	G2
H	5-F	N-Me	G2
H	6-F	N-Me	G2
H	4-Cl	N-Me	G2
H	6-Cl	N-Me	G2
H	4-Br	N-Me	G2
H	4, 6-Me ₂	N-Me	G2
Me	H	N-Me	G2
Me	3-Me	N-Me	G2
Me	4-Me	N-Me	G2
Me	5-Me	N-Me	G2
Me	6-Me	N-Me	G2
Me	4-Et	N-Me	G2
Me	4-t-Bu	N-Me	G2
Me	4-i-Pr	N-Me	G2
Me	4-CF ₃	N-Me	G2
Me	4-OMe	N-Me	G2
Me	6-OMe	N-Me	G2
Me	4-OEt	N-Me	G2
Me	4-SMe	N-Me	G2
Me	4-NMe ₂	N-Me	G2
Me	3-F	N-Me	G2
Me	4-F	N-Me	G2
Me	5-F	N-Me	G2
Me	6-F	N-Me	G2
Me	4-Cl	N-Me	G2
Me	6-Cl	N-Me	G2
Me	4-Br	N-Me	G2
Me	4-I	N-Me	G2
Me	4-CN	N-Me	G2
Me	4, 5-Me ₂	N-Me	G2
Me	4, 6-Me ₂	N-Me	G2
Me	4, 5-(OMe) ₂	N-Me	G2
Et	H	N-Me	G2
Et	4-Me	N-Me	G2
Et	6-Me	N-Me	G2

Et	4-Et	N-Me	G2
Et	4-OMe	N-Me	G2
Et	4-F	N-Me	G2
Et	4-Cl	N-Me	G2
Et	4, 6-Me ₂	N-Me	G2
Pr	H	N-Me	G2
F	H	N-Me	G2
Cl	H	N-Me	G2
Cl	4-Me	N-Me	G2
Cl	6-Me	N-Me	G2
Cl	4-Et	N-Me	G2
Cl	4-OMe	N-Me	G2
Cl	4-F	N-Me	G2
Cl	4-Cl	N-Me	G2
Cl	4, 6-Me ₂	N-Me	G2
Br	H	N-Me	G2
Br	4-Me	N-Me	G2
Br	6-Me	N-Me	G2
Br	4-Et	N-Me	G2
Br	4-OMe	N-Me	G2
Br	4-F	N-Me	G2
Br	4-Cl	N-Me	G2
Br	4, 6-Me ₂	N-Me	G2
H	H	N-Me	G4
H	3-Me	N-Me	G4
H	4-Me	N-Me	G4
H	5-Me	N-Me	G4
H	6-Me	N-Me	G4
H	4-Et	N-Me	G4
H	4-t-Bu	N-Me	G4
H	4-i-Pr	N-Me	G4
H	4-OMe	N-Me	G4
H	6-OMe	N-Me	G4
H	3-F	N-Me	G4
H	4-F	N-Me	G4
H	5-F	N-Me	G4
H	6-F	N-Me	G4
H	4-Cl	N-Me	G4
H	6-Cl	N-Me	G4
H	4-Br	N-Me	G4
H	4, 6-Me ₂	N-Me	G4
Me	H	N-Me	G4
Me	3-Me	N-Me	G4
Me	4-Me	N-Me	G4
Me	5-Me	N-Me	G4
Me	6-Me	N-Me	G4
Me	4-Et	N-Me	G4
Me	4-t-Bu	N-Me	G4
Me	4-i-Pr	N-Me	G4
Me	4-CF ₃	N-Me	G4
Me	4-OMe	N-Me	G4
Me	6-OMe	N-Me	G4
Me	4-OEt	N-Me	G4
Me	4-SMe	N-Me	G4
Me	4-NMe ₂	N-Me	G4
Me	3-F	N-Me	G4
Me	4-F	N-Me	G4
Me	5-F	N-Me	G4

Me	6-F	N-Me	G4
Me	4-Cl	N-Me	G4
Me	6-Cl	N-Me	G4
Me	4-Br	N-Me	G4
Me	4-I	N-Me	G4
Me	4-CN	N-Me	G4
Me	4, 5-Me ₂	N-Me	G4
Me	4, 6-Me ₂	N-Me	G4
Me	4, 5-(OMe) ₂	N-Me	G4
Bt	H	N-Me	G4
Bt	4-Me	N-Me	G4
Bt	6-Me	N-Me	G4
Bt	4-Et	N-Me	G4
Bt	4-OMe	N-Me	G4
Bt	4-F	N-Me	G4
Bt	4-Cl	N-Me	G4
Bt	4, 6-Me ₂	N-Me	G4
Pr	H	N-Me	G4
F	H	N-Me	G4
C1	H	N-Me	G4
C1	4-Me	N-Me	G4
C1	6-Me	N-Me	G4
C1	4-Et	N-Me	G4
C1	4-OMe	N-Me	G4
C1	4-F	N-Me	G4
C1	4-Cl	N-Me	G4
C1	4, 6-Me ₂	N-Me	G4
Br	H	N-Me	G4
Br	4-Me	N-Me	G4
Br	6-Me	N-Me	G4
Br	4-Et	N-Me	G4
Br	4-OMe	N-Me	G4
Br	4-F	N-Me	G4
Br	4-Cl	N-Me	G4
Br	4, 6-Me ₂	N-Me	G4
H	H	N-Me	G5
H	3-Me	N-Me	G5
H	4-Me	N-Me	G5
H	5-Me	N-Me	G5
H	6-Me	N-Me	G5
H	4-Et	N-Me	G5
H	4-t-Bu	N-Me	G5
H	4-i-Pr	N-Me	G5
H	4-OMe	N-Me	G5
H	6-OMe	N-Me	G5
H	3-F	N-Me	G5
H	4-F	N-Me	G5
H	5-F	N-Me	G5
H	6-F	N-Me	G5
H	4-Cl	N-Me	G5
H	6-Cl	N-Me	G5
H	4-Br	N-Me	G5
H	4, 6-Me ₂	N-Me	G5
Me	H	N-Me	G5
Me	3-Me	N-Me	G5
Me	4-Me	N-Me	G5
Me	5-Me	N-Me	G5
Me	6-Me	N-Me	G5

Me	4-Et	N-Me	G5
Me	4-t-Bu	N-Me	G5
Me	4-i-Pr	N-Me	G5
Me	4-CF ₃	N-Me	G5
Me	4-OMe	N-Me	G5
Me	6-OMe	N-Me	G5
Me	4-OEt	N-Me	G5
Me	4-SMe	N-Me	G5
Me	4-NMe ₂	N-Me	G5
Me	3-F	N-Me	G5
Me	4-F	N-Me	G5
Me	5-F	N-Me	G5
Me	6-F	N-Me	G5
Me	4-Cl	N-Me	G5
Me	6-Cl	N-Me	G5
Me	4-Br	N-Me	G5
Me	4-I	N-Me	G5
Me	4-CN	N-Me	G5
Me	4, 5-Me ₂	N-Me	G5
Me	4, 6-Me ₂	N-Me	G5
Me	4, 5-(OMe) ₂	N-Me	G5
Et	H	N-Me	G5
Et	4-Me	N-Me	G5
Et	6-Me	N-Me	G5
Et	4-Et	N-Me	G5
Et	4-OMe	N-Me	G5
Et	4-F	N-Me	G5
Et	4-Cl	N-Me	G5
Et	4, 6-Me ₂	N-Me	G5
Pr	H	N-Me	G5
F	H	N-Me	G5
Cl	H	N-Me	G5
Cl	4-Me	N-Me	G5
Cl	6-Me	N-Me	G5
Cl	4-Et	N-Me	G5
Cl	4-OMe	N-Me	G5
Cl	4-F	N-Me	G5
Cl	4-Cl	N-Me	G5
Cl	4, 6-Me ₂	N-Me	G5
Br	H	N-Me	G5
Br	4-Me	N-Me	G5
Br	6-Me	N-Me	G5
Br	4-Et	N-Me	G5
Br	4-OMe	N-Me	G5
Br	4-F	N-Me	G5
Br	4-Cl	N-Me	G5
Br	4, 6-Me ₂	N-Me	G5
H	H	N-Me	G6
H	3-Me	N-Me	G6
H	4-Me	N-Me	G6
H	5-Me	N-Me	G6
H	6-Me	N-Me	G6
H	4-Et	N-Me	G6
H	4-t-Bu	N-Me	G6
H	4-i-Pr	N-Me	G6
H	4-OMe	N-Me	G6
H	6-OMe	N-Me	G6
H	3-F	N-Me	G6

H	4-F	N-Me	G6
H	5-F	N-Me	G6
H	6-F	N-Me	G6
H	4-Cl	N-Me	G6
H	6-Cl	N-Me	G6
H	4-Br	N-Me	G6
H	4, 6-Me ₂	N-Me	G6
Me	H	N-Me	G6
Me	3-Me	N-Me	G6
Me	4-Me	N-Me	G6
Me	5-Me	N-Me	G6
Me	6-Me	N-Me	G6
Me	4-Et	N-Me	G6
Me	4-t-Bu	N-Me	G6
Me	4-i-Pr	N-Me	G6
Me	4-CF ₃	N-Me	G6
Me	4-OMe	N-Me	G6
Me	6-OMe	N-Me	G6
Me	4-OEt	N-Me	G6
Me	4-SMe	N-Me	G6
Me	4-NMe ₂	N-Me	G6
Me	3-F	N-Me	G6
Me	4-F	N-Me	G6
Me	5-F	N-Me	G6
Me	6-F	N-Me	G6
Me	4-Cl	N-Me	G6
Me	6-Cl	N-Me	G6
Me	4-Br	N-Me	G6
Me	4-I	N-Me	G6
Me	4-CN	N-Me	G6
Me	4, 5-Me ₂	N-Me	G6
Me	4, 6-Me ₂	N-Me	G6
Me	4, 5-(OMe) ₂	N-Me	G6
Bt	H	N-Me	G6
Bt	4-Me	N-Me	G6
Bt	6-Me	N-Me	G6
Bt	4-Et	N-Me	G6
Bt	4-OMe	N-Me	G6
Bt	4-F	N-Me	G6
Bt	4-Cl	N-Me	G6
Bt	4, 6-Me ₂	N-Me	G6
Pr	H	N-Me	G6
F	H	N-Me	G6
Cl	H	N-Me	G6
Cl	4-Me	N-Me	G6
Cl	6-Me	N-Me	G6
Cl	4-Et	N-Me	G6
Cl	4-OMe	N-Me	G6
Cl	4-F	N-Me	G6
Cl	4-Cl	N-Me	G6
Cl	4, 6-Me ₂	N-Me	G6
Br	H	N-Me	G6
Br	4-Me	N-Me	G6
Br	6-Me	N-Me	G6
Br	4-Et	N-Me	G6
Br	4-OMe	N-Me	G6
Br	4-F	N-Me	G6
Br	4-Cl	N-Me	G6

Br	4, 6-Me ₂	N-Me	G6
H	H	N-Me	G11
H	3-Me	N-Me	G11
H	4-Me	N-Me	G11
H	5-Me	N-Me	G11
H	6-Me	N-Me	G11
H	4-Bt	N-Me	G11
H	4-t-Bu	N-Me	G11
H	4-i-Pr	N-Me	G11
H	4-OMe	N-Me	G11
H	6-OMe	N-Me	G11
H	3-F	N-Me	G11
H	4-F	N-Me	G11
H	5-F	N-Me	G11
H	6-F	N-Me	G11
H	4-Cl	N-Me	G11
H	6-Cl	N-Me	G11
H	4-Br	N-Me	G11
H	4, 6-Me ₂	N-Me	G11
Me	H	N-Me	G11
Me	3-Me	N-Me	G11
Me	4-Me	N-Me	G11
Me	5-Me	N-Me	G11
Me	6-Me	N-Me	G11
Me	4-Et	N-Me	G11
Me	4-t-Bu	N-Me	G11
Me	4-i-Pr	N-Me	G11
Me	4-CF ₃	N-Me	G11
Me	4-OMe	N-Me	G11
Me	6-OMe	N-Me	G11
Me	4-OEt	N-Me	G11
Me	4-SMe	N-Me	G11
Me	4-NMe ₂	N-Me	G11
Me	3-F	N-Me	G11
Me	4-F	N-Me	G11
Me	5-F	N-Me	G11
Me	6-F	N-Me	G11
Me	4-Cl	N-Me	G11
Me	6-Cl	N-Me	G11
Me	4-Br	N-Me	G11
Me	4-I	N-Me	G11
Me	4-CN	N-Me	G11
Me	4, 5-Me ₂	N-Me	G11
Me	4, 6-Me ₂	N-Me	G11
Me	4, 5-(OMe) ₂	N-Me	G11
Et	H	N-Me	G11
Et	4-Me	N-Me	G11
Et	6-Me	N-Me	G11
Et	4-Et	N-Me	G11
Et	4-OMe	N-Me	G11
Et	4-F	N-Me	G11
Et	4-Cl	N-Me	G11
Et	4, 6-Me ₂	N-Me	G11
Pr	H	N-Me	G11
F	H	N-Me	G11
Cl	H	N-Me	G11
Cl	4-Me	N-Me	G11
Cl	6-Me	N-Me	G11

C1	4-Et	N-Me	G11
C1	4-OMe	N-Me	G11
C1	4-F	N-Me	G11
C1	4-Cl	N-Me	G11
C1	4, 6-Me ₂	N-Me	G11
Br	H	N-Me	G11
Br	4-Me	N-Me	G11
Br	6-Me	N-Me	G11
Br	4-Et	N-Me	G11
Br	4-OMe	N-Me	G11
Br	4-F	N-Me	G11
Br	4-Cl	N-Me	G11
Br	4, 6-Me ₂	N-Me	G11
H	H	N-Me	G12
H	3-Me	N-Me	G12
H	4-Me	N-Me	G12
H	5-Me	N-Me	G12
H	6-Me	N-Me	G12
H	4-Et	N-Me	G12
H	4-t-Bu	N-Me	G12
H	4-i-Pr	N-Me	G12
H	4-OMe	N-Me	G12
H	6-OMe	N-Me	G12
H	3-F	N-Me	G12
H	4-F	N-Me	G12
H	5-F	N-Me	G12
H	6-F	N-Me	G12
H	4-Cl	N-Me	G12
H	6-Cl	N-Me	G12
H	4-Br	N-Me	G12
H	4, 6-Me ₂	N-Me	G12
Me	H	N-Me	G12
Me	3-Me	N-Me	G12
Me	4-Me	N-Me	G12
Me	5-Me	N-Me	G12
Me	6-Me	N-Me	G12
Me	4-Et	N-Me	G12
Me	4-t-Bu	N-Me	G12
Me	4-i-Pr	N-Me	G12
Me	4-CF ₃	N-Me	G12
Me	4-OMe	N-Me	G12
Me	6-OMe	N-Me	G12
Me	4-OEt	N-Me	G12
Me	4-SMe	N-Me	G12
Me	4-NMe ₂	N-Me	G12
Me	3-F	N-Me	G12
Me	4-F	N-Me	G12
Me	5-F	N-Me	G12
Me	6-F	N-Me	G12
Me	4-Cl	N-Me	G12
Me	6-Cl	N-Me	G12
Me	4-Br	N-Me	G12
Me	4-I	N-Me	G12
Me	4-CN	N-Me	G12
Me	4, 5-Me ₂	N-Me	G12
Me	4, 6-Me ₂	N-Me	G12
Me	4, 5-(OMe) ₂	N-Me	G12
Et	H	N-Me	G12

Et	4-Me	N-Me	G12
Et	6-Me	N-Me	G12
Et	4-Et	N-Me	G12
Et	4-OMe	N-Me	G12
Et	4-F	N-Me	G12
Et	4-Cl	N-Me	G12
Et	4, 6-Me ₂	N-Me	G12
Pr	H	N-Me	G12
F	H	N-Me	G12
Cl	H	N-Me	G12
Cl	4-Me	N-Me	G12
Cl	6-Me	N-Me	G12
Cl	4-Et	N-Me	G12
Cl	4-OMe	N-Me	G12
Cl	4-F	N-Me	G12
Cl	4-Cl	N-Me	G12
Cl	4, 6-Me ₂	N-Me	G12
Br	H	N-Me	G12
Br	4-Me	N-Me	G12
Br	6-Me	N-Me	G12
Br	4-Et	N-Me	G12
Br	4-OMe	N-Me	G12
Br	4-F	N-Me	G12
Br	4-Cl	N-Me	G12
Br	4, 6-Me ₂	N-Me	G12
H	H	N-Me	G13
H	3-Me	N-Me	G13
H	4-Me	N-Me	G13
H	5-Me	N-Me	G13
H	6-Me	N-Me	G13
H	4-Et	N-Me	G13
H	4-t-Bu	N-Me	G13
H	4-i-Pr	N-Me	G13
H	4-OMe	N-Me	G13
H	6-OMe	N-Me	G13
H	3-F	N-Me	G13
H	4-F	N-Me	G13
H	5-F	N-Me	G13
H	6-F	N-Me	G13
H	4-Cl	N-Me	G13
H	6-Cl	N-Me	G13
H	4-Br	N-Me	G13
H	4, 6-Me ₂	N-Me	G13
Me	H	N-Me	G13
Me	3-Me	N-Me	G13
Me	4-Me	N-Me	G13
Me	5-Me	N-Me	G13
Me	6-Me	N-Me	G13
Me	4-Et	N-Me	G13
Me	4-t-Bu	N-Me	G13
Me	4-i-Pr	N-Me	G13
Me	4-CF ₃	N-Me	G13
Me	4-OMe	N-Me	G13
Me	6-OMe	N-Me	G13
Me	4-OEt	N-Me	G13
Me	4-SMe	N-Me	G13
Me	4-NMe ₂	N-Me	G13
Me	3-F	N-Me	G13

Me	4-F	N-Me	G13
Me	5-F	N-Me	G13
Me	6-F	N-Me	G13
Me	4-Cl	N-Me	G13
Me	6-Cl	N-Me	G13
Me	4-Br	N-Me	G13
Me	4-I	N-Me	G13
Me	4-CN	N-Me	G13
Me	4, 5-Me ₂	N-Me	G13
Me	4, 6-Me ₂	N-Me	G13
Me	4, 5-(OMe) ₂	N-Me	G13
Et	H	N-Me	G13
Et	4-Me	N-Me	G13
Et	6-Me	N-Me	G13
Et	4-Et	N-Me	G13
Et	4-OMe	N-Me	G13
Et	4-F	N-Me	G13
Et	4-Cl	N-Me	G13
Et	4, 6-Me ₂	N-Me	G13
Pr	H	N-Me	G13
F	H	N-Me	G13
Cl	H	N-Me	G13
Cl	4-Me	N-Me	G13
Cl	6-Me	N-Me	G13
Cl	4-Et	N-Me	G13
Cl	4-OMe	N-Me	G13
Cl	4-F	N-Me	G13
Cl	4-Cl	N-Me	G13
Cl	4, 6-Me ₂	N-Me	G13
Br	H	N-Me	G13
Br	4-Me	N-Me	G13
Br	6-Me	N-Me	G13
Br	4-Et	N-Me	G13
Br	4-OMe	N-Me	G13
Br	4-F	N-Me	G13
Br	4-Cl	N-Me	G13
Br	4, 6-Me ₂	N-Me	G13
H	H	N-Me	G14
H	3-Me	N-Me	G14
H	4-Me	N-Me	G14
H	5-Me	N-Me	G14
H	6-Me	N-Me	G14
H	4-Et	N-Me	G14
H	4-t-Bu	N-Me	G14
H	4-i-Pr	N-Me	G14
H	4-OMe	N-Me	G14
H	6-OMe	N-Me	G14
H	3-F	N-Me	G14
H	4-F	N-Me	G14
H	5-F	N-Me	G14
H	6-F	N-Me	G14
H	4-Cl	N-Me	G14
H	6-Cl	N-Me	G14
H	4-Br	N-Me	G14
H	4, 6-Me ₂	N-Me	G14
Me	H	N-Me	G14
Me	3-Me	N-Me	G14
Me	4-Me	N-Me	G14

Me	5-Me	N-Me	G14
Me	6-Me	N-Me	G14
Me	4-Et	N-Me	G14
Me	4-t-Bu	N-Me	G14
Me	4-i-Pr	N-Me	G14
Me	4-CF ₃	N-Me	G14
Me	4-OMe	N-Me	G14
Me	6-OMe	N-Me	G14
Me	4-OEt	N-Me	G14
Me	4-SMe	N-Me	G14
Me	4-NMe ₂	N-Me	G14
Me	3-F	N-Me	G14
Me	4-F	N-Me	G14
Me	5-F	N-Me	G14
Me	6-F	N-Me	G14
Me	4-Cl	N-Me	G14
Me	6-Cl	N-Me	G14
Me	4-Br	N-Me	G14
Me	4-I	N-Me	G14
Me	4-CN	N-Me	G14
Me	4, 5-Me ₂	N-Me	G14
Me	4, 6-Me ₂	N-Me	G14
Me	4, 5-(OMe) ₂	N-Me	G14
Bt	H	N-Me	G14
Bt	4-Me	N-Me	G14
Bt	6-Me	N-Me	G14
Bt	4-Et	N-Me	G14
Bt	4-OMe	N-Me	G14
Bt	4-F	N-Me	G14
Bt	4-Cl	N-Me	G14
Bt	4, 6-Me ₂	N-Me	G14
Pr	H	N-Me	G14
F	H	N-Me	G14
Cl	H	N-Me	G14
Cl	4-Me	N-Me	G14
Cl	6-Me	N-Me	G14
Cl	4-Et	N-Me	G14
Cl	4-OMe	N-Me	G14
Cl	4-F	N-Me	G14
Cl	4-Cl	N-Me	G14
Cl	4, 6-Me ₂	N-Me	G14
Br	H	N-Me	G14
Br	4-Me	N-Me	G14
Br	6-Me	N-Me	G14
Br	4-Et	N-Me	G14
Br	4-OMe	N-Me	G14
Br	4-F	N-Me	G14
Br	4-Cl	N-Me	G14
Br	4, 6-Me ₂	N-Me	G14
H	H	N-Me	G15
H	3-Me	N-Me	G15
H	4-Me	N-Me	G15
H	5-Me	N-Me	G15
H	6-Me	N-Me	G15
H	4-Et	N-Me	G15
H	4-t-Bu	N-Me	G15
H	4-i-Pr	N-Me	G15
H	4-OMe	N-Me	G15

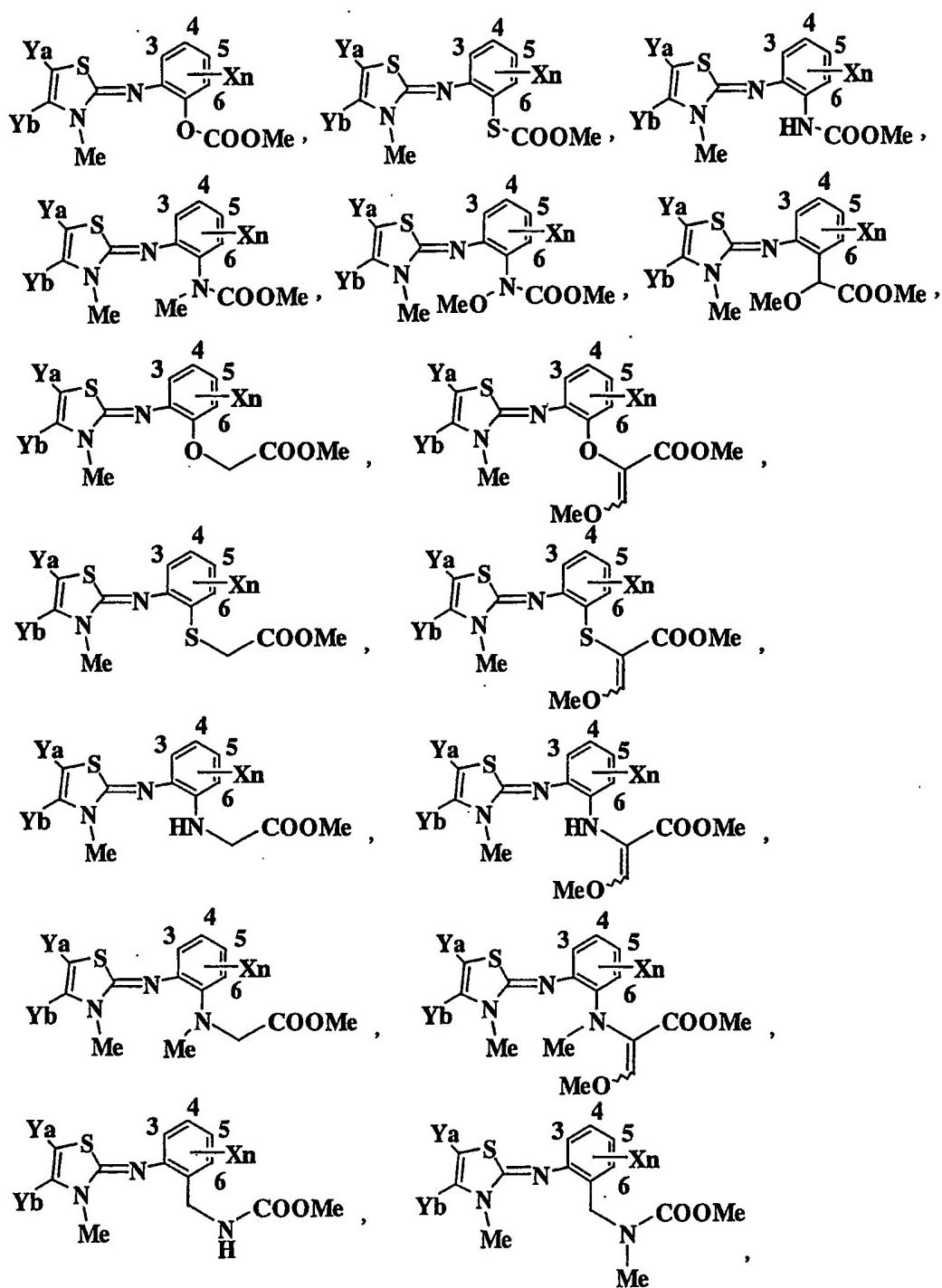
H	6-OMe	N-Me	G15
H	3-F	N-Me	G15
H	4-F	N-Me	G15
H	5-F	N-Me	G15
H	6-F	N-Me	G15
H	4-Cl	N-Me	G15
H	6-Cl	N-Me	G15
H	4-Br	N-Me	G15
H	4, 6-Me ₂	N-Me	G15
Me	H	N-Me	G15
Me	3-Me	N-Me	G15
Me	4-Me	N-Me	G15
Me	5-Me	N-Me	G15
Me	6-Me	N-Me	G15
Me	4-Et	N-Me	G15
Me	4-t-Bu	N-Me	G15
Me	4-i-Pr	N-Me	G15
Me	4-CF ₃	N-Me	G15
Me	4-OMe	N-Me	G15
Me	6-OMe	N-Me	G15
Me	4-OEt	N-Me	G15
Me	4-SMe	N-Me	G15
Me	4-NMe ₂	N-Me	G15
Me	3-F	N-Me	G15
Me	4-F	N-Me	G15
Me	5-F	N-Me	G15
Me	6-F	N-Me	G15
Me	4-Cl	N-Me	G15
Me	6-Cl	N-Me	G15
Me	4-Br	N-Me	G15
Me	4-I	N-Me	G15
Me	4-CN	N-Me	G15
Me	4, 5-Me ₂	N-Me	G15
Me	4, 6-Me ₂	N-Me	G15
Me	4, 5-(OMe) ₂	N-Me	G15
Et	H	N-Me	G15
Et	4-Me	N-Me	G15
Et	6-Me	N-Me	G15
Et	4-Et	N-Me	G15
Et	4-OMe	N-Me	G15
Et	4-F	N-Me	G15
Et	4-Cl	N-Me	G15
Et	4, 6-Me ₂	N-Me	G15
Pr	H	N-Me	G15
F	H	N-Me	G15
Cl	H	N-Me	G15
Cl	4-Me	N-Me	G15
Cl	6-Me	N-Me	G15
Cl	4-Et	N-Me	G15
Cl	4-OMe	N-Me	G15
Cl	4-F	N-Me	G15
Cl	4-Cl	N-Me	G15
Cl	4, 6-Me ₂	N-Me	G15
Br	H	N-Me	G15
Br	4-Me	N-Me	G15
Br	6-Me	N-Me	G15
Br	4-Et	N-Me	G15
Br	4-OMe	N-Me	G15

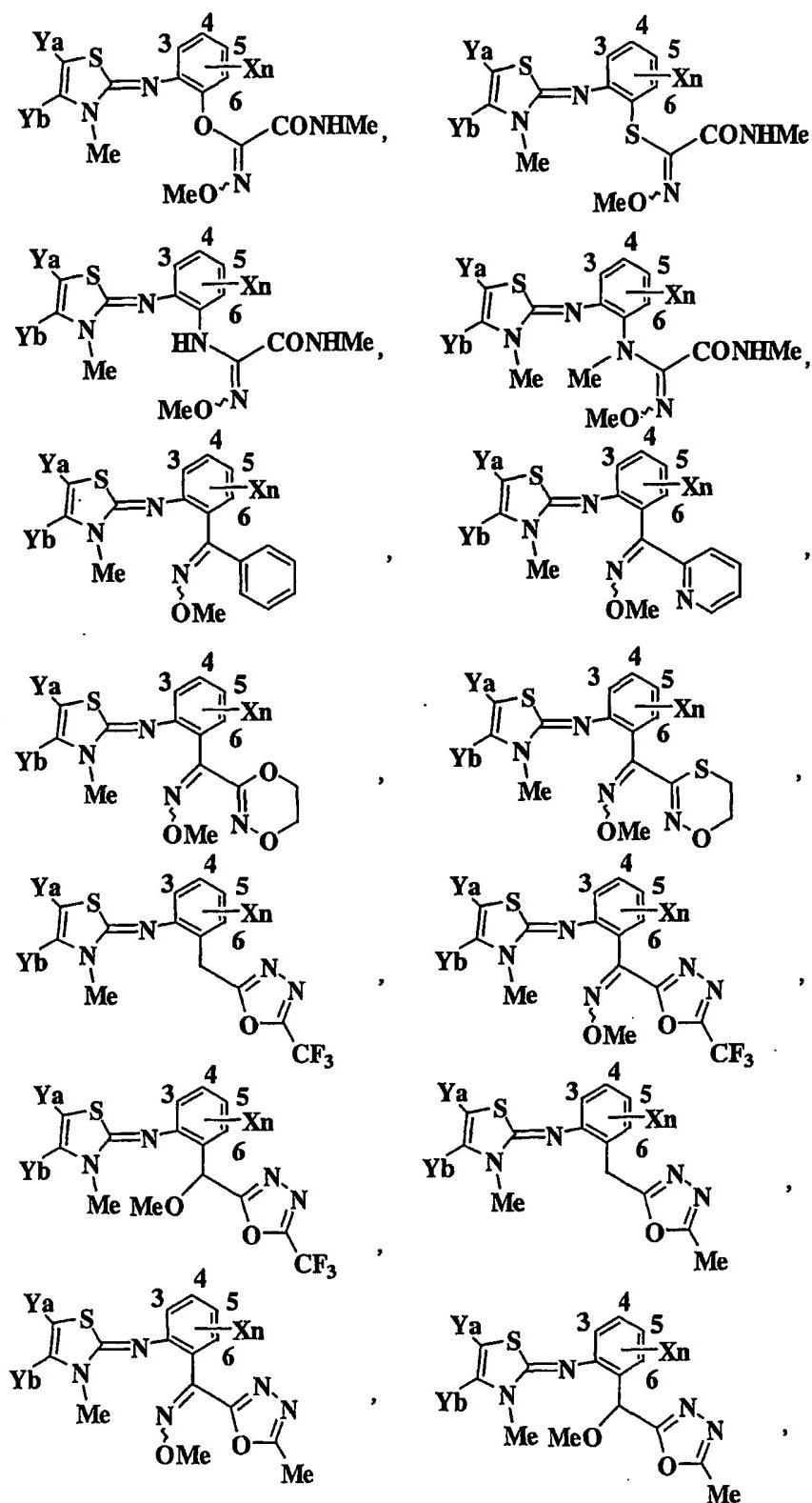
Br	4-F	N-Me	G15
Br	4-Cl	N-Me	G15
Br	4, 6-Me ₂	N-Me	G15
H	H	N-Me	G16
H	3-Me	N-Me	G16
H	4-Me	N-Me	G16
H	5-Me	N-Me	G16
H	6-Me	N-Me	G16
H	4-Et	N-Me	G16
H	4-t-Bu	N-Me	G16
H	4-i-Pr	N-Me	G16
H	4-OMe	N-Me	G16
H	6-OMe	N-Me	G16
H	3-F	N-Me	G16
H	4-F	N-Me	G16
H	5-F	N-Me	G16
H	6-F	N-Me	G16
H	4-Cl	N-Me	G16
H	6-Cl	N-Me	G16
H	4-Br	N-Me	G16
H	4, 6-Me ₂	N-Me	G16
Me	H	N-Me	G16
Me	3-Me	N-Me	G16
Me	4-Me	N-Me	G16
Me	5-Me	N-Me	G16
Me	6-Me	N-Me	G16
Me	4-Et	N-Me	G16
Me	4-t-Bu	N-Me	G16
Me	4-i-Pr	N-Me	G16
Me	4-CF ₃	N-Me	G16
Me	4-OMe	N-Me	G16
Me	6-OMe	N-Me	G16
Me	4-OEt	N-Me	G16
Me	4-SMe	N-Me	G16
Me	4-NMe ₂	N-Me	G16
Me	3-F	N-Me	G16
Me	4-F	N-Me	G16
Me	5-F	N-Me	G16
Me	6-F	N-Me	G16
Me	4-Cl	N-Me	G16
Me	6-Cl	N-Me	G16
Me	4-Br	N-Me	G16
Me	4-I	N-Me	G16
Me	4-CN	N-Me	G16
Me	4, 5-Me ₂	N-Me	G16
Me	4, 6-Me ₂	N-Me	G16
Me	4, 5-(OMe) ₂	N-Me	G16
Et	H	N-Me	G16
Et	4-Me	N-Me	G16
Et	6-Me	N-Me	G16
Et	4-Et	N-Me	G16
Et	4-OMe	N-Me	G16
Et	4-F	N-Me	G16
Et	4-Cl	N-Me	G16
Et	4, 6-Me ₂	N-Me	G16
Pr	H	N-Me	G16
F	H	N-Me	G16
Cl	H	N-Me	G16

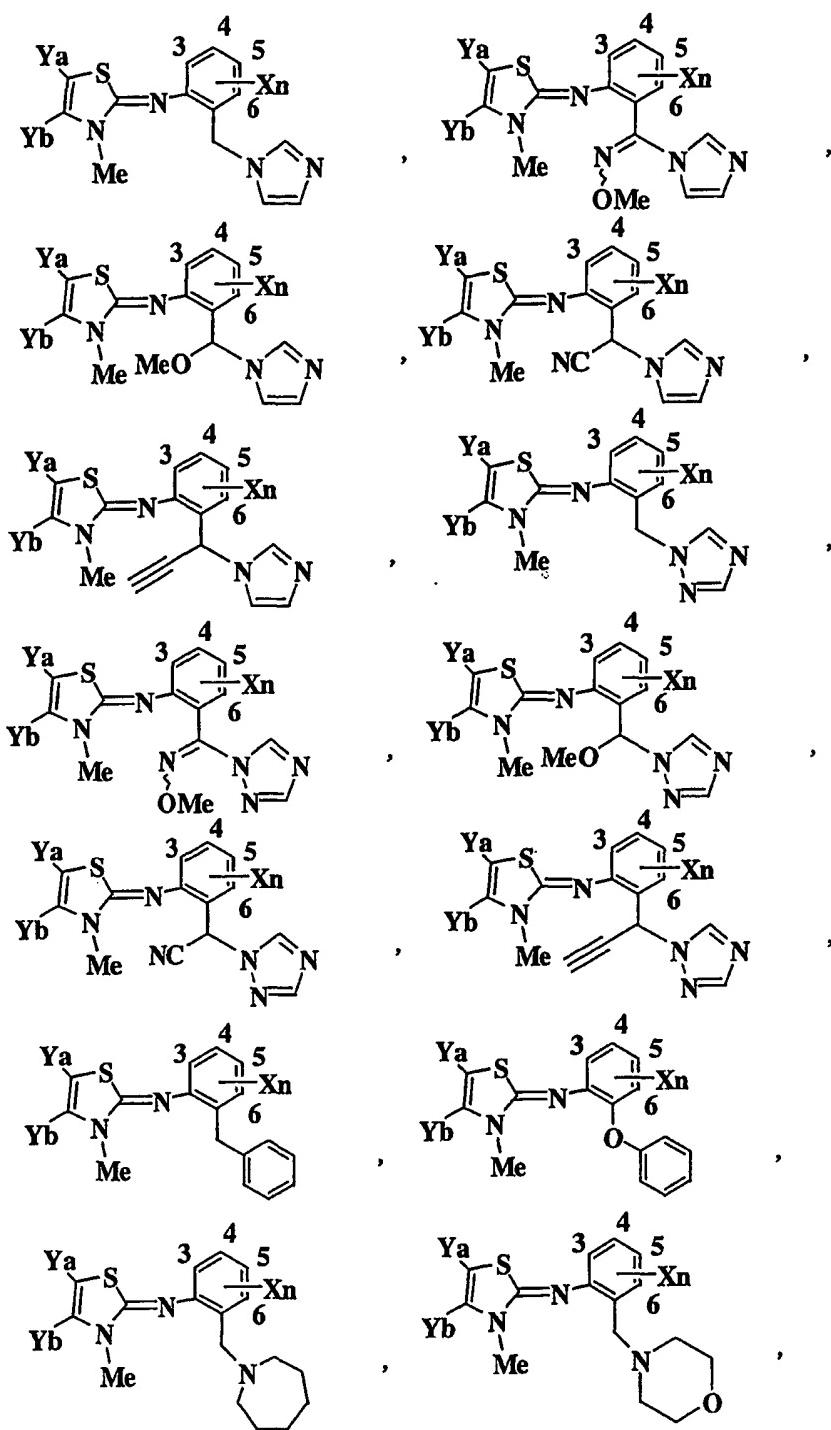
C1	4-Me	N-Me	G16
C1	6-Me	N-Me	G16
C1	4-Et	N-Me	G16
C1	4-OMe	N-Me	G16
C1	4-F	N-Me	G16
C1	4-Cl	N-Me	G16
C1	4, 6-Me ₂	N-Me	G16
Br	H	N-Me	G16
Br	4-Me	N-Me	G16
Br	6-Me	N-Me	G16
Br	4-Et	N-Me	G16
Br	4-OMe	N-Me	G16
Br	4-F	N-Me	G16
Br	4-Cl	N-Me	G16
Br	4, 6-Me ₂	N-Me	G16
H	H	N-Me	G17
H	3-Me	N-Me	G17
H	4-Me	N-Me	G17
H	5-Me	N-Me	G17
H	6-Me	N-Me	G17
H	4-Et	N-Me	G17
H	4-t-Bu	N-Me	G17
H	4-i-Pr	N-Me	G17
H	4-OMe	N-Me	G17
H	6-OMe	N-Me	G17
H	3-F	N-Me	G17
H	4-F	N-Me	G17
H	5-F	N-Me	G17
H	6-F	N-Me	G17
H	4-Cl	N-Me	G17
H	6-Cl	N-Me	G17
H	4-Br	N-Me	G17
H	4, 6-Me ₂	N-Me	G17
Me	H	N-Me	G17
Me	3-Me	N-Me	G17
Me	4-Me	N-Me	G17
Me	5-Me	N-Me	G17
Me	6-Me	N-Me	G17
Me	4-Et	N-Me	G17
Me	4-t-Bu	N-Me	G17
Me	4-i-Pr	N-Me	G17
Me	4-CF ₃	N-Me	G17
Me	4-OMe	N-Me	G17
Me	6-OMe	N-Me	G17
Me	4-OEt	N-Me	G17
Me	4-SMe	N-Me	G17
Me	4-NMe ₂	N-Me	G17
Me	3-F	N-Me	G17
Me	4-F	N-Me	G17
Me	5-F	N-Me	G17
Me	6-F	N-Me	G17
Me	4-Cl	N-Me	G17
Me	6-Cl	N-Me	G17
Me	4-Br	N-Me	G17
Me	4-I	N-Me	G17
Me	4-CN	N-Me	G17
Me	4, 5-Me ₂	N-Me	G17
Me	4, 6-Me ₂	N-Me	G17

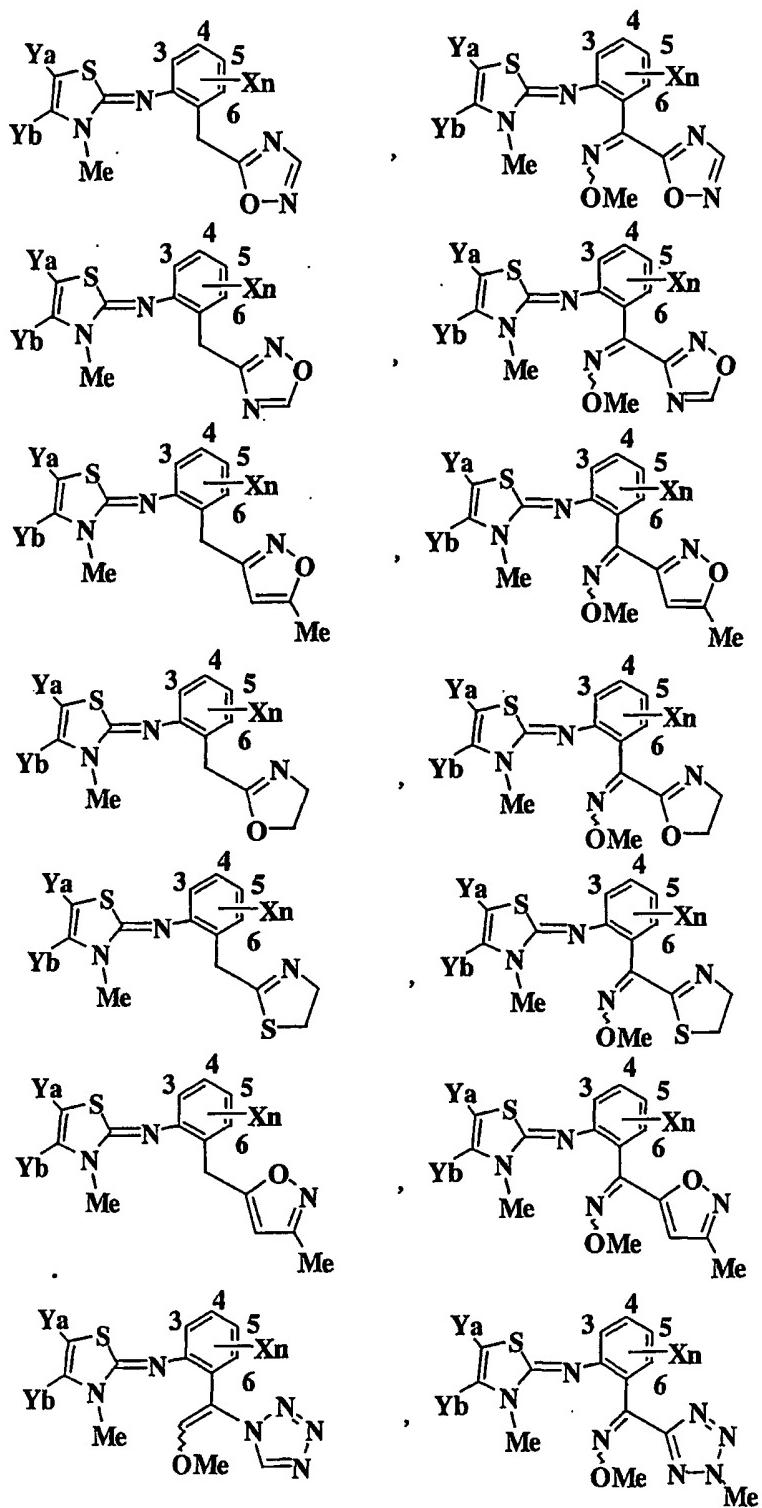
Me	4, 5-(OMe) ₂	N-Me	G17
Et	H	N-Me	G17
Et	4-Me	N-Me	G17
Et	6-Me	N-Me	G17
Et	4-Et	N-Me	G17
Et	4-OMe	N-Me	G17
Et	4-F	N-Me	G17
Et	4-Cl	N-Me	G17
Et	4, 6-Me ₂	N-Me	G17
Pr	H	N-Me	G17
F	H	N-Me	G17
Cl	H	N-Me	G17
Cl	4-Me	N-Me	G17
Cl	6-Me	N-Me	G17
Cl	4-Et	N-Me	G17
Cl	4-OMe	N-Me	G17
Cl	4-F	N-Me	G17
Cl	4-Cl	N-Me	G17
Cl	4, 6-Me ₂	N-Me	G17
Br	H	N-Me	G17
Br	4-Me	N-Me	G17
Br	6-Me	N-Me	G17
Br	4-Et	N-Me	G17
Br	4-OMe	N-Me	G17
Br	4-F	N-Me	G17
Br	4-Cl	N-Me	G17
Br	4, 6-Me ₂	N-Me	G17

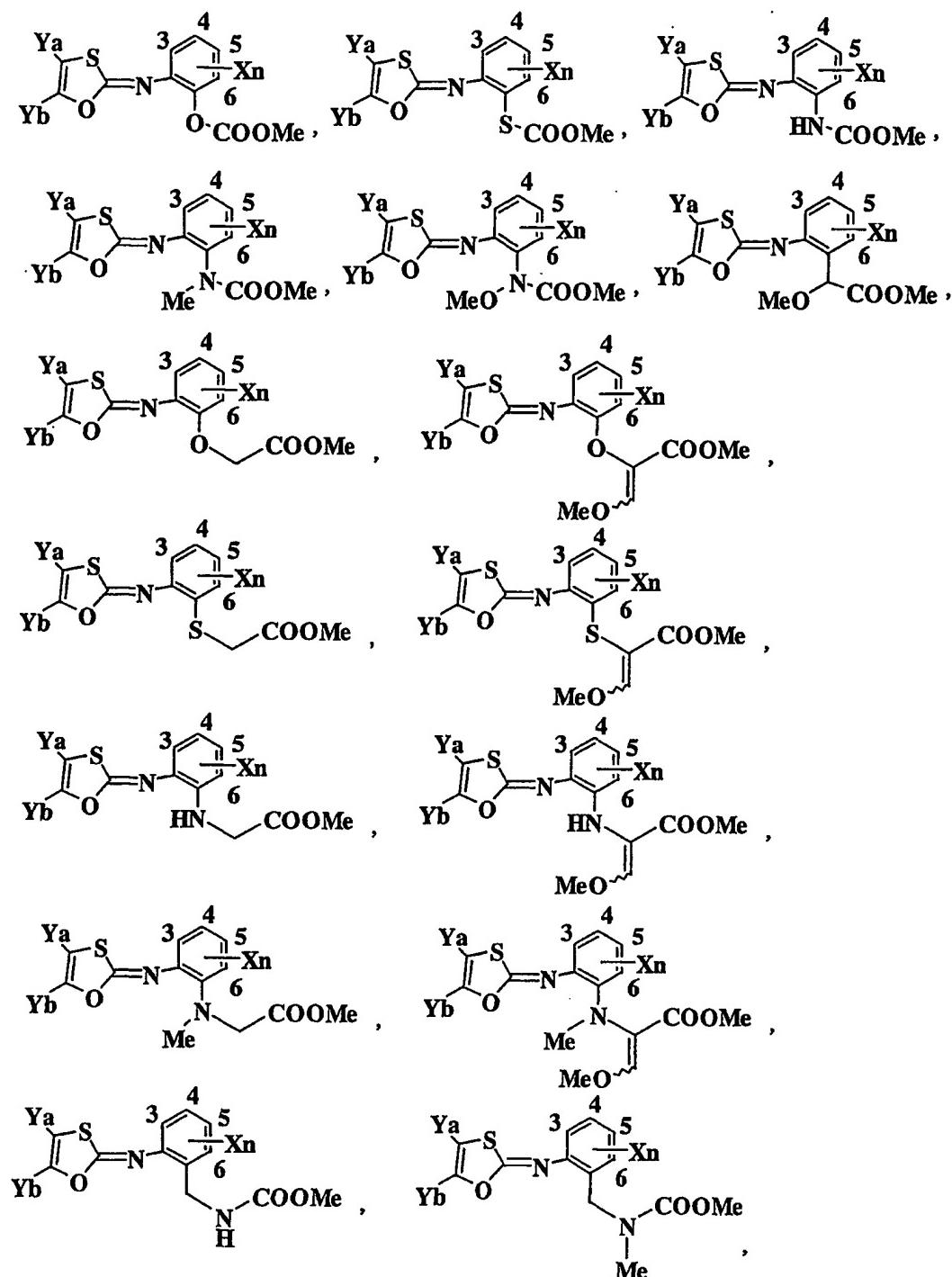
〔第4表〕

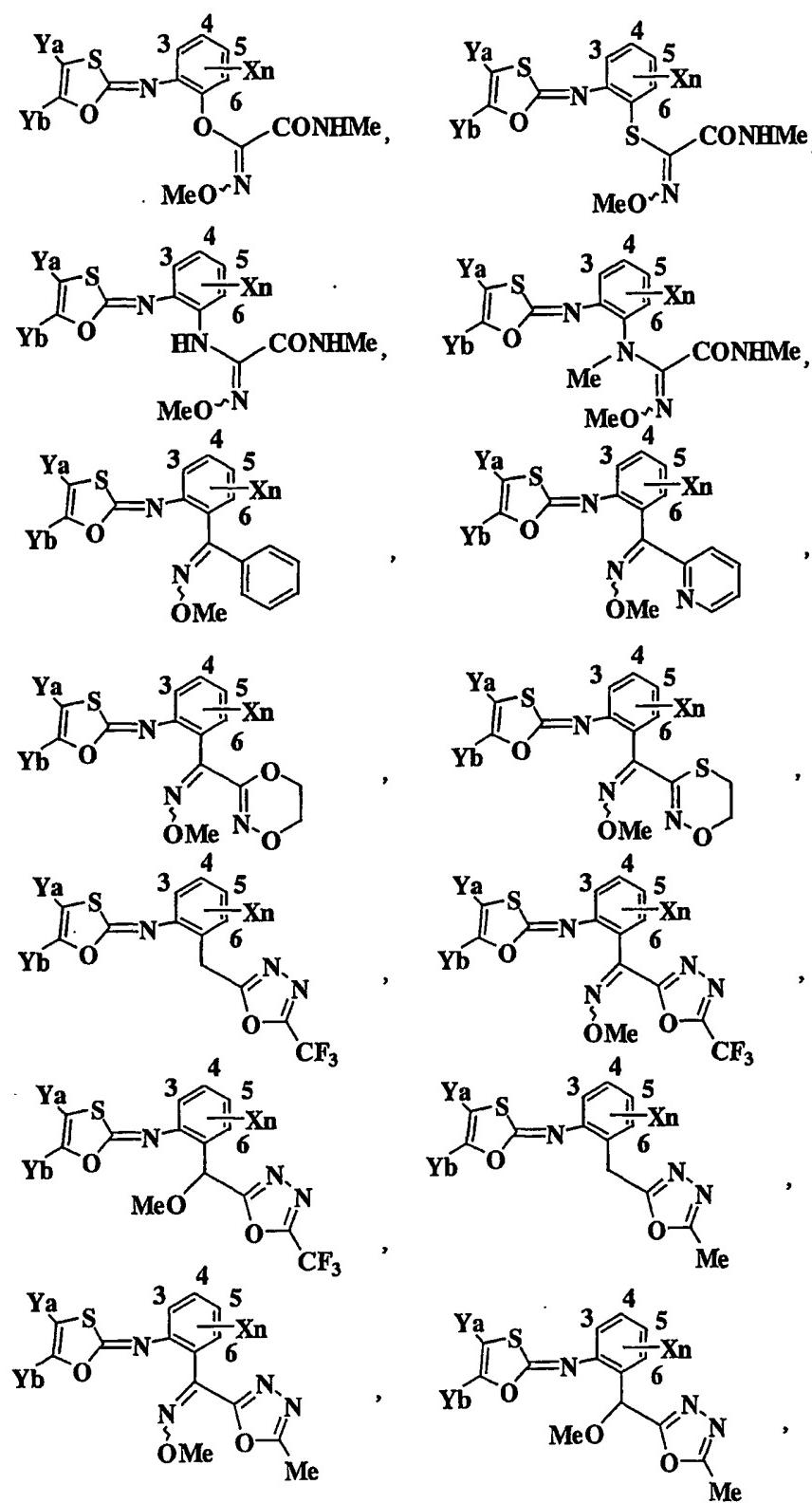


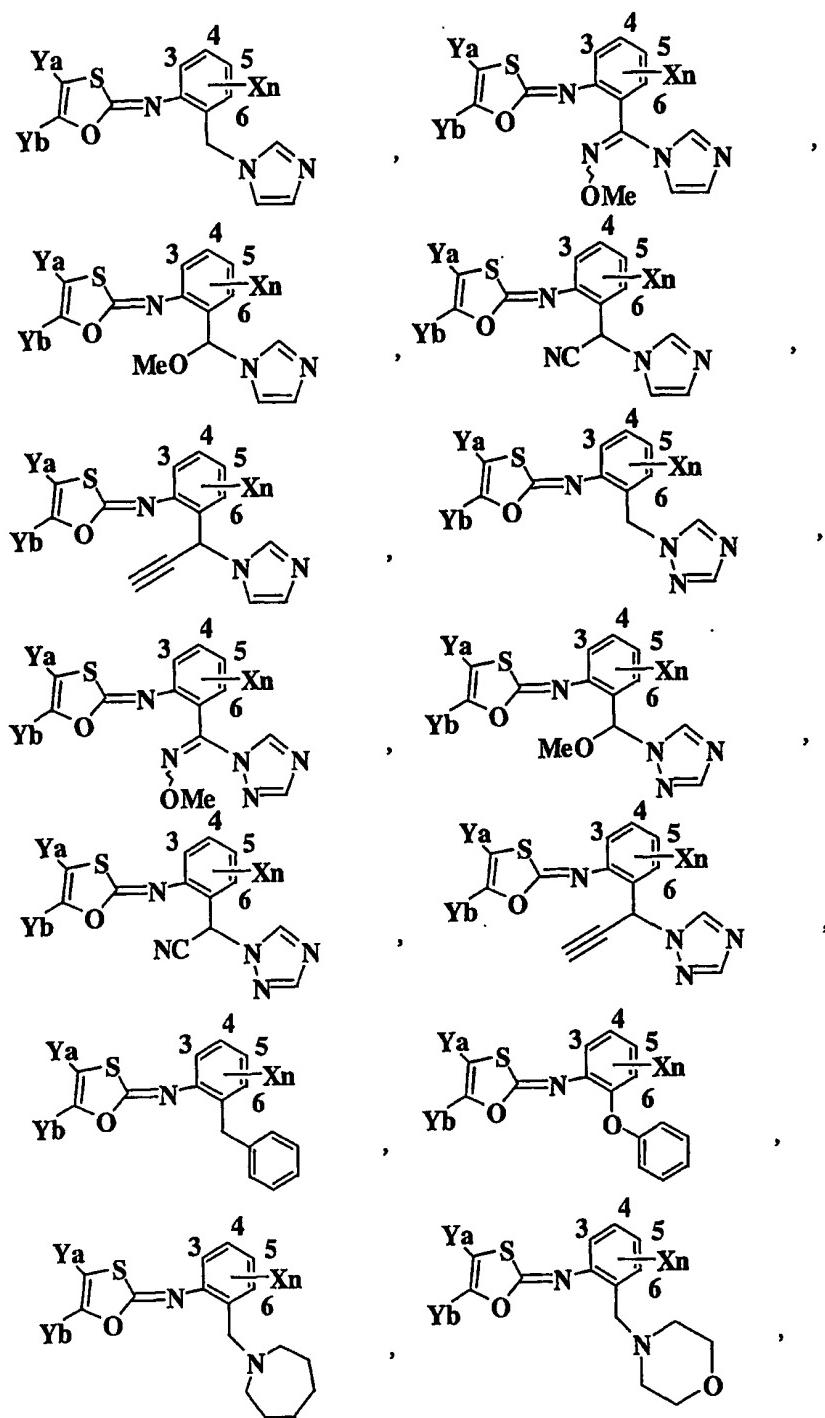


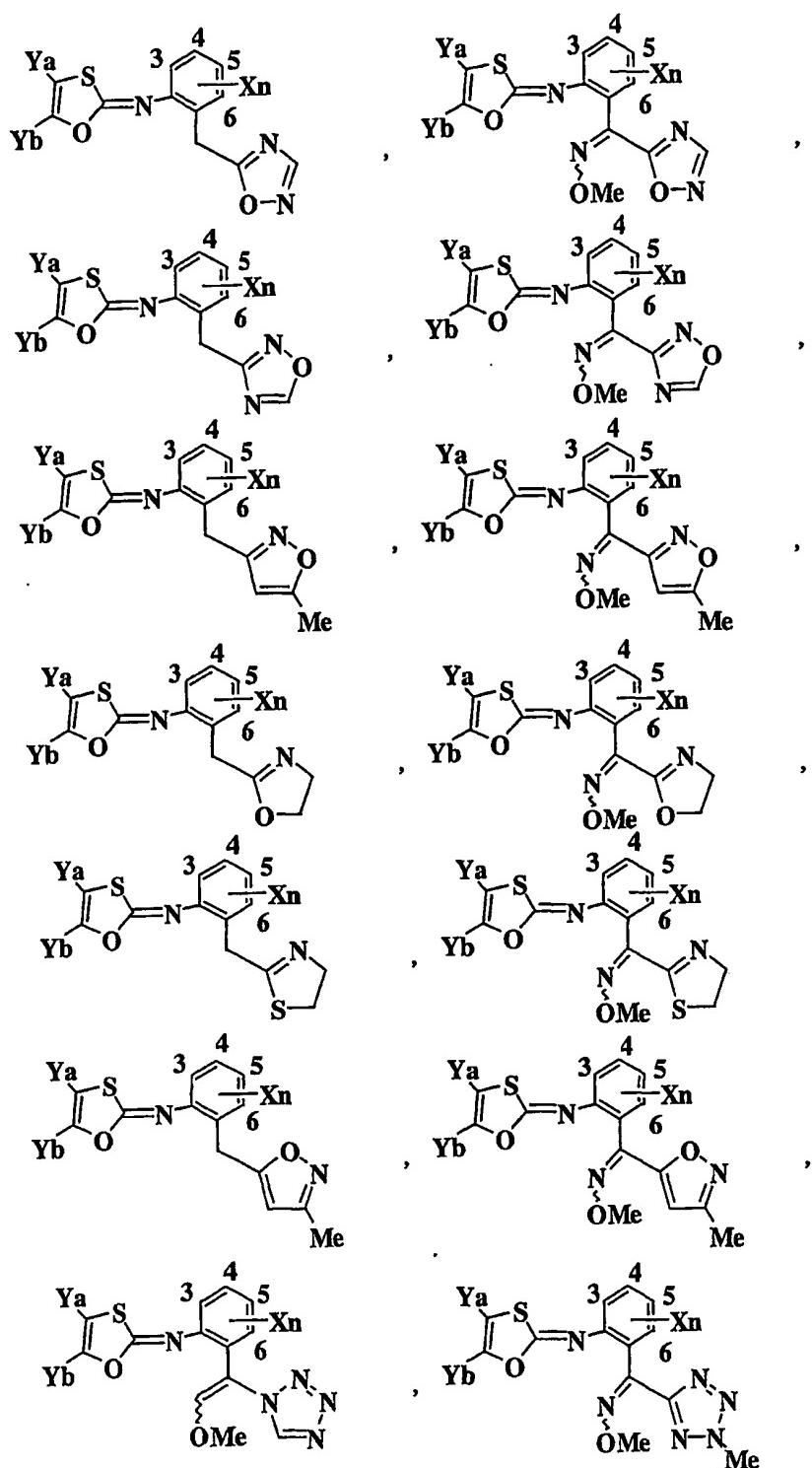


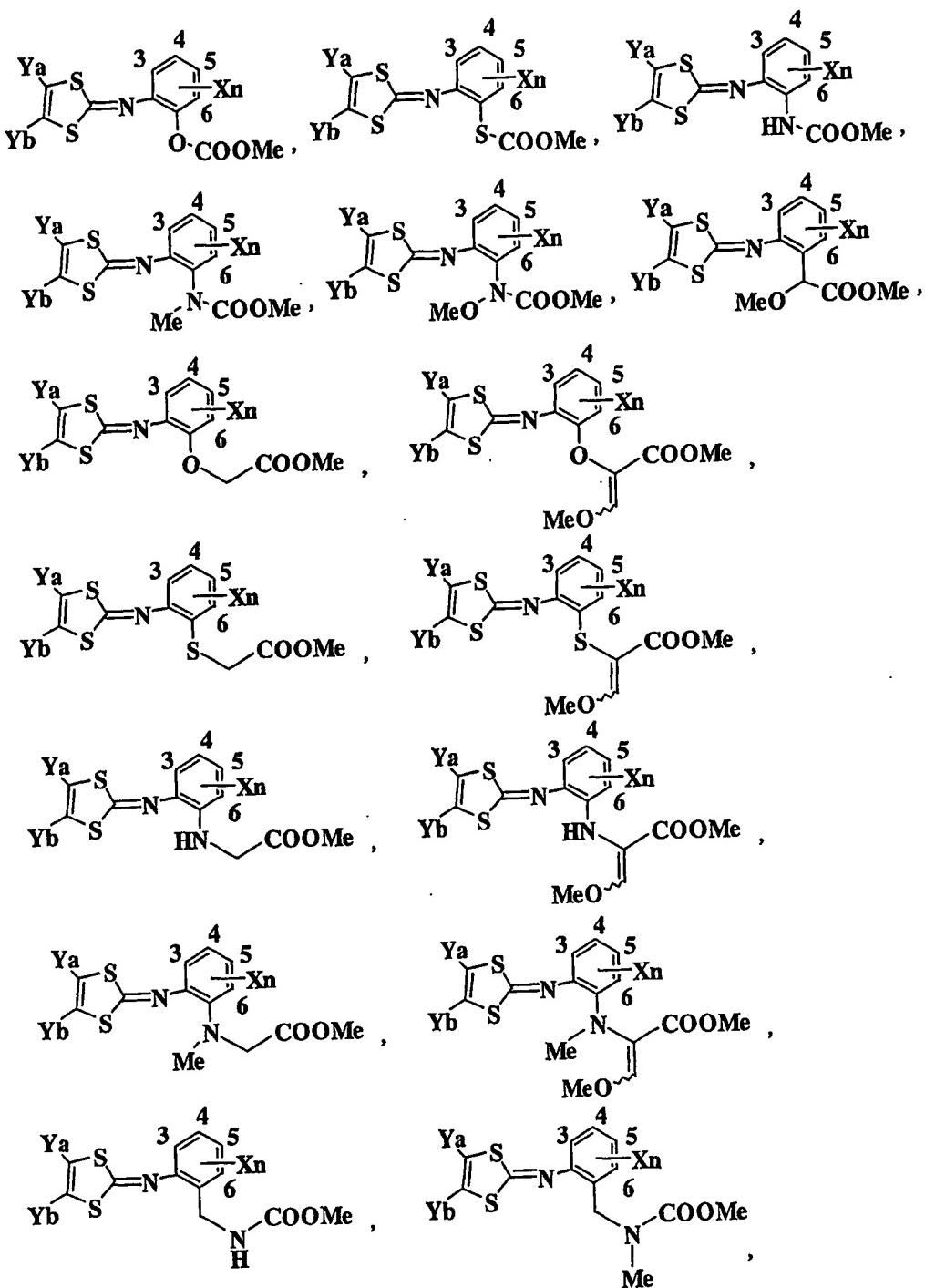


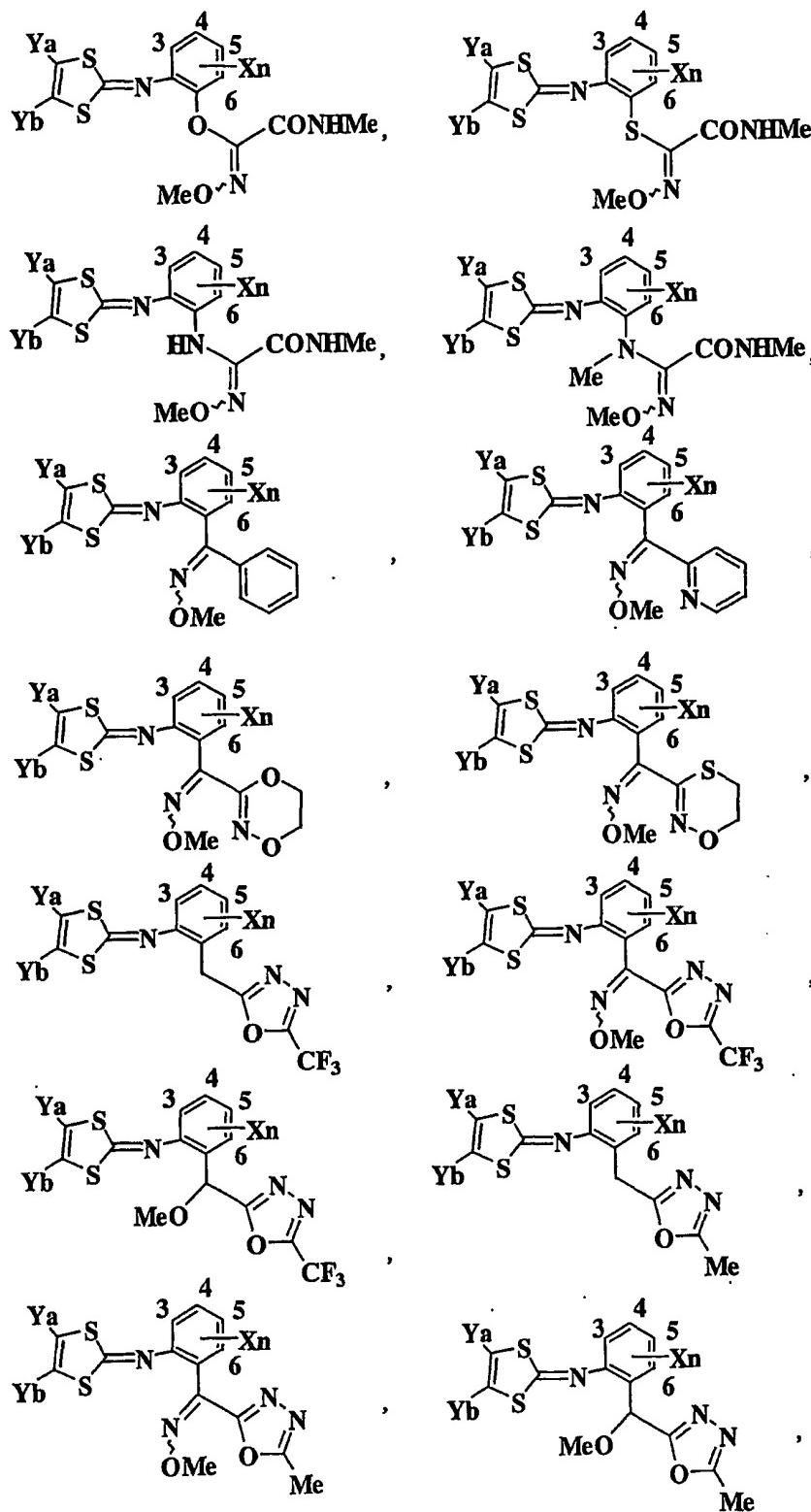


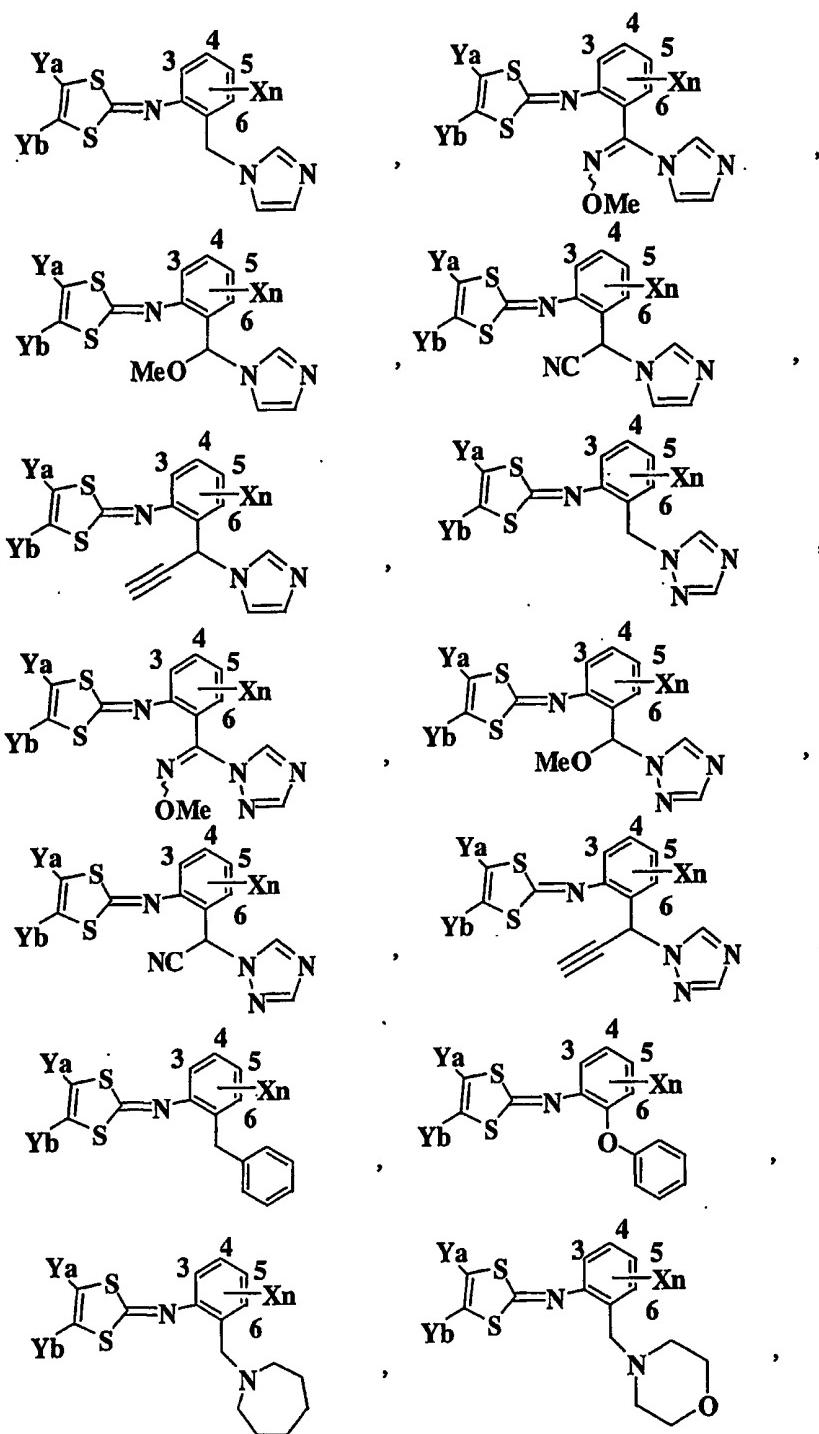


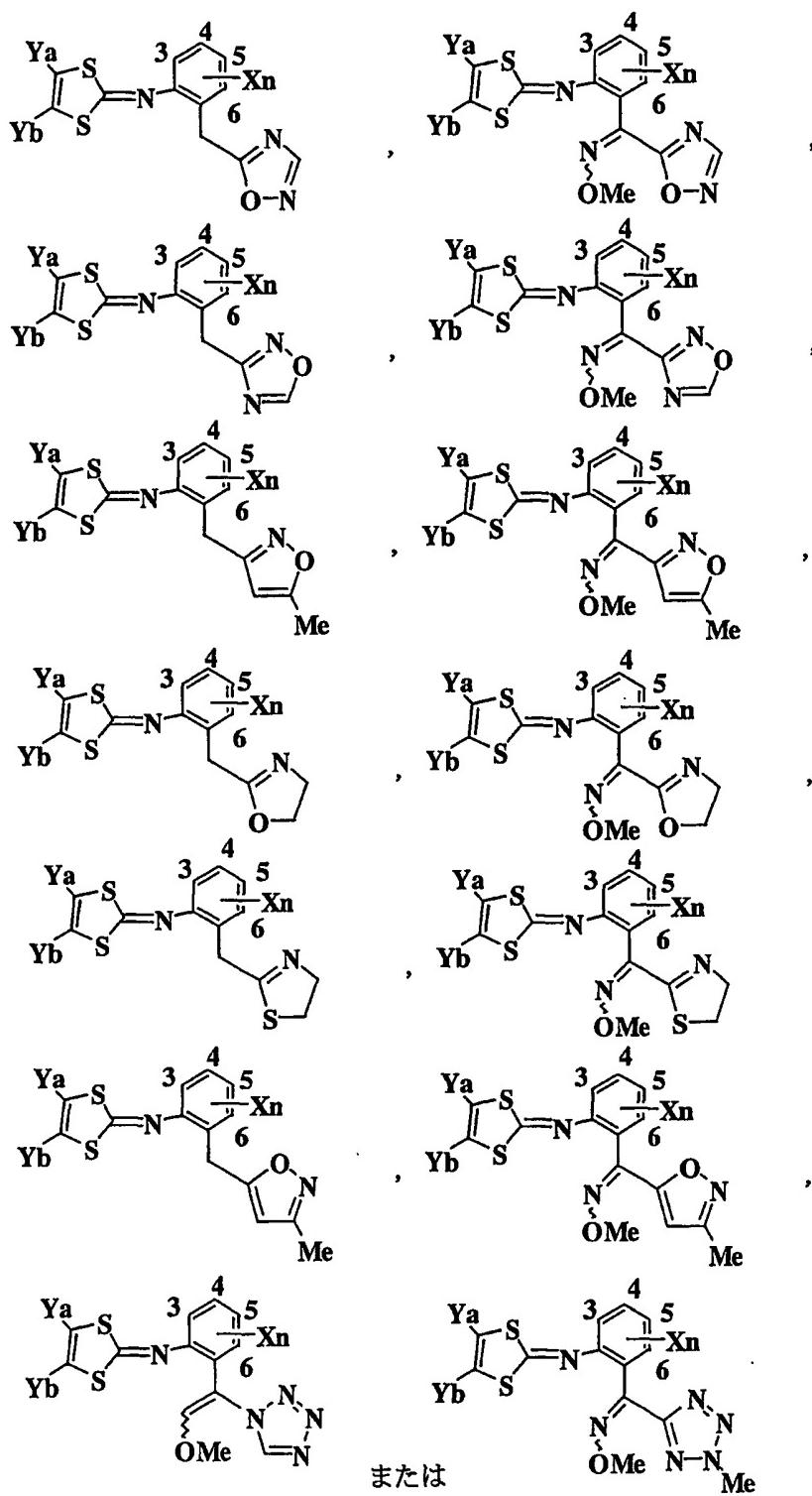












Y a	Y b	X n
H	H	H
H	Br	H
H	Me	H
H	Et	H
H	n-Pr	H
H	i-Pr	H
H	n-Bu	H
H	i-Bu	H
H	s-Bu	H
H	t-Bu	H
H	CF ₃	H
H	c-Pr	H
H	PhCH ₂	H
H	PhCH=CH	H
H	4-Cl-PHCH=CH	H
H	PhCH=CHCH ₂	H
H	Ph	H
H	MeNHC(0)	H
H	PhNHC(0)	H
H	EtNHC(0)	H
H	2-F-PhNHC(0)	H
H	3-F-PhNHC(0)	H
H	4-F-PhNHC(0)	H
H	2-Cl-PhNHC(0)	H
H	3-Cl-PhNHC(0)	H
H	4-Cl-PhNHC(0)	H
H	2-Me-PhNHC(0)	H
H	3-Me-PhNHC(0)	H
H	4-Me-PhNHC(0)	H
H	2-Br-PhNHC(0)	H
H	3-Br-PhNHC(0)	H
H	4-Br-PhNHC(0)	H
H	2-MeO-PhNHC(0)	H
H	3-MeO-PhNHC(0)	H
H	4-MeO-PhNHC(0)	H
H	2, 6-F ₂ -PhNHC(0)	H
H	MeOCO	H
H	MeOCH ₂	H
H	MeOC(=NOMe)	H
H	MeC(=NOMe)	H
H	COMe	H
H	CH ₂ SMe	H
H	CH ₂ SCH ₂ Ph	H
H	Pyrazol-1-ylCH ₂	H
H	ClCH ₂	H
H	BrCH ₂	H
H	CF ₃ CF ₂	H
H	PhCONH	H
H	1-Naphthyl	H
H	2-Naphthyl	H
H	1-Me-Pyrazol-5-yl	H
H	Thiophen-2-yl	H
H	Thiazol-5-yl	H
H	Pyridin-4-yl	H
H	Quinoxalin-2-yl	H
H	6-Cl-Quinoxalin-2-yl	H

H	6-F-Quinoxalin-2-yl	H
H	2-Cl-Ph	H
H	3-Cl-Ph	H
H	4-Cl-Ph	H
H	2-F-Ph	H
H	3-F-Ph	H
H	4-F-Ph	H
H	2-Me-Ph	H
H	3-Me-Ph	H
H	4-Me-Ph	H
H	2-MeO-Ph	H
H	3-MeO-Ph	H
H	4-MeO-Ph	H
H	4-Br-Ph	H
H	2,4-Cl ₂ -Ph	H
H	3,4-Cl ₂ -Ph	H
H	2,4,6-Cl ₃ -Ph	H
H	3,4-(MeO) ₂ -Ph	H
H	2-Cl-4-Me-Ph	H
H	2-MeO-4-Me-Ph	H
H	2,4-Me ₂ -Ph	H
H	2,5-Me ₂ -Ph	H
H	2,6-F ₂ -Ph	H
H	2,3,4,5,6-F ₅ -Ph	H
H	4-Et-Ph	H
H	4-i-Pr-Ph	H
H	4-t-Bu-Ph	H
H	4-CF ₃ -Ph	H
H	4-i-PrO-Ph	H
H	4-t-BuO-Ph	H
H	4-CHF ₂ O-Ph	H
H	4-CF ₃ O-Ph	H
H	4-MeS-Ph	H
H	4-PhCH ₂ O-Ph	H
H	4-Ph-Ph	H
H	4-PhO-Ph	H
H	2,3-Cl ₂ -Ph	H
H	3,5-Cl ₂ -Ph	H
H	2,6-Cl ₂ -Ph	H
H	2,5-Cl ₂ -Ph	H
H	2,3-F ₂ -Ph	H
H	2,5-F ₂ -Ph	H
H	3,4-F ₂ -Ph	H
H	3,5-F ₂ -Ph	H
H	2,4-F ₂ -Ph	H
H	2-CF ₃ -Ph	H
H	2-F-6-CF ₃ -Ph	H
H	2-F-6-Cl-Ph	H
H	2-F-6-Me-Ph	H
H	2-F-6-MeO-Ph	H
H	2-F-4-Cl-Ph	H
H	2-F-4-CF ₃ -Ph	H
H	2-F-4-Me-Ph	H
H	2-F-4-MeO-Ph	H
H	3-F-4-Cl-Ph	H
H	3-F-4-Me-Ph	H
H	3-F-4-MeO-Ph	H
H	4-F-2-Cl-Ph	H

H	4-F-2-Me-Ph	H
H	4-F-2-MeO-Ph	H
H	4-F-3-Cl-Ph	H
H	4-F-3-Me-Ph	H
H	4-F-3-MeO-Ph	H
H	4-I-Ph	H
H	2, 6-Me ₂ -Ph	H
H	2, 6-(MeO) ₂ -Ph	H
H	3-CF ₃ -Ph	H
H	2-Br-Ph	H
H	3-Br-Ph	H
H	2, 3-Me ₂ -Ph	H
H	3, 4-Me ₂ -Ph	H
H	3, 5-Me ₂ -Ph	H
H	Ph	4-Cl
H	Ph	4-Me
H	Ph	6-Me
H	Ph	4-F
H	Ph	4-MeO
H	Ph	4, 5-Me ₂
H	Ph	4, 6-Me ₂
H	Ph	4, 5-(MeO) ₂
H	Ph	4-t-Bu
H	Ph	4-CN
H	Ph	4-Et
H	Ph	4-COO <i>Me</i>
H	Ph	4-COMe
H	Ph	4-COPh
H	2-Cl-Ph	4-Cl
H	2-Cl-Ph	4-CF ₃
H	2-Cl-Ph	4-Me
H	2-Cl-Ph	6-Me
H	2-Cl-Ph	4-F
H	2-Cl-Ph	4-MeO
H	2-Cl-Ph	4-t-Bu
H	2-Cl-Ph	4-Et
H	3-Cl-Ph	4-Cl
H	3-Cl-Ph	4-Me
H	3-Cl-Ph	6-Me
H	3-Cl-Ph	4-F
H	3-Cl-Ph	4-MeO
H	4-Cl-Ph	4-Cl
H	4-Cl-Ph	4-Me
H	4-Cl-Ph	6-Me
H	4-Cl-Ph	4-F
H	4-Cl-Ph	4-MeO
H	2-Me-Ph	4-Cl
H	2-Me-Ph	4-Me
H	2-Me-Ph	4-F
H	2-Me-Ph	4-MeO
H	3-Me-Ph	4-Cl
H	3-Me-Ph	4-Me
H	3-Me-Ph	6-Me
H	3-Me-Ph	4-F
H	3-Me-Ph	4-MeO
H	4-Me-Ph	4-Cl
H	4-Me-Ph	4-Me
H	4-Me-Ph	6-Me

H	4-Me-Ph	4-F
H	4-Me-Ph	4-MeO
H	4-Me-Ph	4-Et
H	2-F-Ph	4-Cl
H	2-F-Ph	4-Me
H	2-F-Ph	6-Me
H	2-F-Ph	4-F
H	2-F-Ph	4-MeO
H	2-F-Ph	4-Et
H	3-F-Ph	4-Cl
H	3-F-Ph	4-Me
H	3-F-Ph	6-Me
H	3-F-Ph	4-F
H	3-F-Ph	4-MeO
H	4-F-Ph	4-Cl
H	4-F-Ph	4-Me
H	4-F-Ph	6-Me
H	4-F-Ph	4-F
H	4-F-Ph	4-MeO
H	4-F-Ph	4-Et
H	4-F-Ph	4-Cl
H	2-MeO-Ph	4-Me
H	2-MeO-Ph	6-Me
H	2-MeO-Ph	4-F
H	2-MeO-Ph	4-MeO
H	2-MeO-Ph	4-Cl
H	3-MeO-Ph	4-Me
H	3-MeO-Ph	6-Me
H	3-MeO-Ph	4-F
H	3-MeO-Ph	4-MeO
H	4-MeO-Ph	4-Cl
H	4-MeO-Ph	4-Me
H	4-MeO-Ph	6-Me
H	4-MeO-Ph	4-F
H	4-MeO-Ph	4-MeO
H	2-Br-Ph	4-Cl
H	2-Br-Ph	4-Me
H	2-Br-Ph	6-Me
H	2-Br-Ph	4-F
H	2-Br-Ph	4-MeO
H	3-Br-Ph	4-Cl
H	3-Br-Ph	4-Me
H	3-Br-Ph	4-F
H	3-Br-Ph	4-MeO
H	4-Br-Ph	4-Cl
H	4-Br-Ph	4-Me
H	4-Br-Ph	4-F
H	4-Br-Ph	4-MeO
H	4-Et-Ph	4-Cl
H	4-Et-Ph	4-Me
H	4-Et-Ph	4-F
H	4-Et-Ph	4-MeO
H	2, 6-F ₂ -Ph	4-Cl
H	2, 6-F ₂ -Ph	4-Me
H	2, 6-F ₂ -Ph	6-Me
H	2, 6-F ₂ -Ph	4-F
H	2, 6-F ₂ -Ph	4-MeO
H	2, 6-F ₂ -Ph	4-t-Bu

H	2, 6-F ₂ -Ph	4-Et
H	2, 6-F ₂ -Ph	4-COOMe
H	2, 5-F ₂ -Ph	4-Cl
H	2, 5-F ₂ -Ph	4-Me
H	2, 5-F ₂ -Ph	6-Me
H	2, 5-F ₂ -Ph	4-F
H	2, 5-F ₂ -Ph	4-MeO
H	2, 5-F ₂ -Ph	4-Et
H	2, 4-F ₂ -Ph	4-Cl
H	2, 4-F ₂ -Ph	4-Me
H	2, 4-F ₂ -Ph	6-Me
H	2, 4-F ₂ -Ph	4-F
H	2, 4-F ₂ -Ph	4-MeO
H	2, 4-F ₂ -Ph	4-Et
H	2, 3-F ₂ -Ph	4-Cl
H	2, 3-F ₂ -Ph	4-Me
H	2, 3-F ₂ -Ph	6-Me
H	2, 3-F ₂ -Ph	4-F
H	2, 3-F ₂ -Ph	4-MeO
H	2, 3-F ₂ -Ph	4-Et
H	3, 4-F ₂ -Ph	4-Cl
H	3, 4-F ₂ -Ph	4-Me
H	3, 4-F ₂ -Ph	6-Me
H	3, 4-F ₂ -Ph	4-F
H	3, 4-F ₂ -Ph	4-MeO
H	3, 4-F ₂ -Ph	4-Et
H	3, 5-F ₂ -Ph	4-Cl
H	3, 5-F ₂ -Ph	4-Me
H	3, 5-F ₂ -Ph	6-Me
H	3, 5-F ₂ -Ph	4-F
H	3, 5-F ₂ -Ph	4-MeO
H	3, 5-F ₂ -Ph	4-Et
H	2-F-4-Me-Ph	4-Cl
H	2-F-4-Me-Ph	4-Me
H	2-F-4-Me-Ph	6-Me
H	2-F-4-Me-Ph	4-F
H	2-F-4-Me-Ph	4-MeO
H	2-F-4-Me-Ph	4, 5-Me ₂
H	2-F-4-Me-Ph	4, 6-Me ₂
H	2-F-4-Me-Ph	4, 5-(MeO) ₂
H	2-F-4-Me-Ph	4-t-Bu
H	2-F-4-Me-Ph	4-Et
H	2-F-4-Et-Ph	4-Cl
H	2-F-4-Et-Ph	4-Me
H	2-F-4-Et-Ph	6-Me
H	2-F-4-Et-Ph	4-F
H	2-F-4-Et-Ph	4-MeO
H	2-F-4-Et-Ph	4-Et
H	2-F-6-MeO-Ph	4-Cl
H	2-F-6-MeO-Ph	4-Me
H	2-F-6-MeO-Ph	6-Me
H	2-F-6-MeO-Ph	4-F
H	2-F-6-MeO-Ph	6-F
H	2-F-6-MeO-Ph	4-MeO
H	2, 6-Cl ₂ -Ph	4-Cl
H	2, 6-Cl ₂ -Ph	4-Me
H	2, 6-Cl ₂ -Ph	6-Me
H	2, 6-Cl ₂ -Ph	4-F

H	2, 6-Cl ₂ -Ph	4-MeO
H	2, 6-Cl ₂ -Ph	4-Et
H	2, 5-Cl ₂ -Ph	4-Cl
H	2, 5-Cl ₂ -Ph	4-Me
H	2, 5-Cl ₂ -Ph	4-F
H	2, 5-Cl ₂ -Ph	4-MeO
H	2, 4-Cl ₂ -Ph	4-Cl
H	2, 4-Cl ₂ -Ph	4-Me
H	2, 4-Cl ₂ -Ph	6-Me
H	2, 4-Cl ₂ -Ph	4-F
H	2, 4-Cl ₂ -Ph	4-MeO
H	2, 4-Cl ₂ -Ph	4-Et
H	2, 3-Cl ₂ -Ph	4-Cl
H	2, 3-Cl ₂ -Ph	4-Me
H	2, 3-Cl ₂ -Ph	6-Me
H	2, 3-Cl ₂ -Ph	4-F
H	2, 3-Cl ₂ -Ph	4-MeO
H	3, 4-Cl ₂ -Ph	4-Cl
H	3, 4-Cl ₂ -Ph	4-Me
H	3, 4-Cl ₂ -Ph	4-F
H	3, 4-Cl ₂ -Ph	4-MeO
H	3, 5-Cl ₂ -Ph	4-Cl
H	3, 5-Cl ₂ -Ph	4-Me
H	3, 5-Cl ₂ -Ph	6-Me
H	3, 5-Cl ₂ -Ph	4-F
H	3, 5-Cl ₂ -Ph	4-MeO
H	2, 6-Me ₂ -Ph	4-Cl
H	2, 6-Me ₂ -Ph	4-Me
H	2, 6-Me ₂ -Ph	4-F
H	2, 6-Me ₂ -Ph	4-MeO
H	2, 5-Me ₂ -Ph	4-Cl
H	2, 5-Me ₂ -Ph	4-Me
H	2, 5-Me ₂ -Ph	4-F
H	2, 5-Me ₂ -Ph	4-MeO
H	2, 4-Me ₂ -Ph	4-Cl
H	2, 4-Me ₂ -Ph	4-Me
H	2, 4-Me ₂ -Ph	4-F
H	2, 4-Me ₂ -Ph	4-MeO
H	2, 3-Me ₂ -Ph	4-Cl
H	2, 3-Me ₂ -Ph	4-Me
H	2, 3-Me ₂ -Ph	4-F
H	2, 3-Me ₂ -Ph	4-MeO
H	3, 4-Me ₂ -Ph	4-Cl
H	3, 4-Me ₂ -Ph	4-Me
H	3, 4-Me ₂ -Ph	4-F
H	3, 4-Me ₂ -Ph	4-MeO
H	3, 5-Me ₂ -Ph	4-Cl
H	3, 5-Me ₂ -Ph	4-Me
H	3, 5-Me ₂ -Ph	4-F
H	3, 5-Me ₂ -Ph	4-MeO
	- (CH ₂) ₃ -	H
	- (CH ₂) ₄ -	H
	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -	H
Me	H	H
Me	Me	H
Me	Et	H
Me	n-Pr	H
Me	i-Pr	H

Me	n-Bu	H
Me	i-Bu	H
Me	s-Bu	H
Me	t-Bu	H
Me	n-Pen	H
Me	3-Me-n-Bu	H
Me	n-Hex	H
Me	Ethenyl	H
Me	1-Propenyl	H
Me	Ethyneyl	H
Me	CF ₃	H
Me	c-Pr	H
Me	c-Hex	H
Me	MeO	H
Me	MeS	H
Me	PhCH ₂	H
Me	PhCH=CH	H
Me	4-Cl-PhCH=CH	H
Me	PhCH=CHCH ₂	H
Me	PhCC	H
Me	Ph	H
Me	MeNHC(O)	H
Me	PhNHC(O)	H
Me	EtNHC(O)	H
Me	2-F-PhNHC(O)	H
Me	3-F-PhNHC(O)	H
Me	4-F-PhNHC(O)	H
Me	2-Cl-PhNHC(O)	H
Me	3-Cl-PhNHC(O)	H
Me	4-Cl-PhNHC(O)	H
Me	2-Me-PhNHC(O)	H
Me	3-Me-PhNHC(O)	H
Me	4-Me-PhNHC(O)	H
Me	2-Br-PhNHC(O)	H
Me	3-Br-PhNHC(O)	H
Me	2-MeO-PhNHC(O)	H
Me	3-MeO-PhNHC(O)	H
Me	4-MeO-PhNHC(O)	H
Me	2, 6-F ₂ -PhNHC(O)	H
Me	MeOCO	H
Me	MeOCH ₂	H
Me	MeOC(=NOMe)	H
Me	MeC(=NOMe)	H
Me	COMe	H
Me	CH ₂ SMe	H
Me	CH ₂ SCH ₂ Ph	H
Me	Pyrazol-1-ylCH ₂	H
Me	ClCH ₂	H
Me	BrCH ₂	H
Me	CF ₃ CF ₂	H
Me	PhCONH	H
Me	1-Naphthyl	H
Me	2-Naphthyl	H
Me	1-Me-Pyrazol-5-yl	H
Me	Thiophen-2-yl	H
Me	Pyridin-4-yl	H
Me	Quinoxalin-2-yl	H

Me	6-Cl-Quinoxalin-2-yl	H
Me	Ph	H
Me	2-Cl-Ph	H
Me	3-Cl-Ph	H
Me	4-Cl-Ph	H
Me	2-F-Ph	H
Me	3-F-Ph	H
Me	4-F-Ph	H
Me	2-Me-Ph	H
Me	3-Me-Ph	H
Me	4-Me-Ph	H
Me	2-MeO-Ph	H
Me	3-MeO-Ph	H
Me	4-MeO-Ph	H
Me	4-Br-Ph	H
Me	2, 4-Cl ₂ -Ph	H
Me	3, 4-Cl ₂ -Ph	H
Me	2, 4, 6-Cl ₃ -Ph	H
Me	3, 4-(MeO) ₂ -Ph	H
Me	2-Cl-4-Me-Ph	H
Me	2-MeO-4-Me-Ph	H
Me	2, 4-Me ₂ -Ph	H
Me	2, 5-Me ₂ -Ph	H
Me	2, 6-F ₂ -Ph	H
Me	2, 3, 4, 5, 6-F ₅ -Ph	H
Me	4-Et-Ph	H
Me	4-i-Pr-Ph	H
Me	4-t-Bu-Ph	H
Me	4-CF ₃ -Ph	H
Me	4-i-PrO-Ph	H
Me	4-t-BuO-Ph	H
Me	4-CHF ₂ O-Ph	H
Me	4-CF ₃ O-Ph	H
Me	4-MeS-Ph	H
Me	4-CHO-Ph	H
Me	4-NO ₂ -Ph	H
Me	4-CN-Ph	H
Me	4-PhCH ₂ O-Ph	H
Me	4-MeC(=O)-Ph	H
Me	4-PhC(=O)-Ph	H
Me	4-MeOCH ₂ -Ph	H
Me	4-MeSCH ₂ -Ph	H
Me	4-MeC(=O)O-Ph	H
Me	4-Ph-Ph	H
Me	4-PhO-Ph	H
Me	2, 3-Cl ₂ -Ph	H
Me	3, 5-Cl ₂ -Ph	H
Me	2, 6-Cl ₂ -Ph	H
Me	2, 5-Cl ₂ -Ph	H
Me	2, 3-F ₂ -Ph	H
Me	2, 5-F ₂ -Ph	H
Me	3, 4-F ₂ -Ph	H
Me	3, 5-F ₂ -Ph	H
Me	2, 4-F ₂ -Ph	H
Me	2-CF ₃ -Ph	H
Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	H
Me	2-F-6-Cl-Ph	H
Me	2-F-6-Me-Ph	H

Me	2-F-6-MeO-Ph	H
Me	2-F-4-Cl-Ph	H
Me	2-F-4-CF ₃ -Ph	H
Me	2-F-4-Me-Ph	H
Me	2-F-4-MeO-Ph	H
Me	3-F-4-Cl-Ph	H
Me	3-F-4-Me-Ph	H
Me	3-F-4-MeO-Ph	H
Me	4-F-2-Cl-Ph	H
Me	4-F-2-Me-Ph	H
Me	4-F-2-MeO-Ph	H
Me	4-F-3-Cl-Ph	H
Me	4-F-3-Me-Ph	H
Me	4-F-3-MeO-Ph	H
Me	2-OH-Ph	H
Me	4-I-Ph	H
Me	4-MeOC(O)-Ph	H
Me	2, 6-Me ₂ -Ph	H
Me	2, 6-(MeO) ₂ -Ph	H
Me	3-CF ₃ -Ph	H
Me	2-Br-Ph	H
Me	3-Br-Ph	H
Me	2-MeC(O)-Ph	H
Me	4-c-Pr-Ph	H
Me	4-PhS-Ph	H
Me	2, 3-Me ₂ -Ph	H
Me	3, 4-Me ₂ -Ph	H
Me	3, 5-Me ₂ -Ph	H
Me	2, 3-(MeO) ₂ -Ph	H
Me	2, 4-(MeO) ₂ -Ph	H
Me	2, 5-(MeO) ₂ -Ph	H
Me	3, 5-(MeO) ₂ -Ph	H
Me	2-F-4-I-Ph	H
Me	2-F-4-EtO-Ph	H
Me	2-F-6-Ph-Ph	H
Me	Ph	4-Cl
Me	Ph	4-Me
Me	Ph	6-Me
Me	Ph	4-F
Me	Ph	4-MeO
Me	Ph	4, 5-Me ₂
Me	Ph	4, 6-Me ₂
Me	Ph	4, 5-(MeO) ₂
Me	Ph	4-t-Bu
Me	Ph	4-CN
Me	Ph	4-Et
Me	Ph	4-COOMe
Me	Ph	4-COMe
Me	Ph	4-COPh
Me	Ph	4-Cl
Me	2-Cl-Ph	4-CF ₃
Me	2-Cl-Ph	4-Me
Me	2-Cl-Ph	6-Me
Me	2-Cl-Ph	4-F
Me	2-Cl-Ph	4-MeO
Me	2-Cl-Ph	4-t-Bu
Me	2-Cl-Ph	4-Et
Me	3-Cl-Ph	4-Cl

Me	3-Cl-Ph	4-Me
Me	3-Cl-Ph	6-Me
Me	3-Cl-Ph	4-F
Me	3-Cl-Ph	4-MeO
Me	4-Cl-Ph	4-Cl
Me	4-Cl-Ph	4-Me
Me	4-Cl-Ph	6-Me
Me	4-Cl-Ph	4-F
Me	4-Cl-Ph	4-MeO
Me	2-Me-Ph	4-Cl
Me	2-Me-Ph	4-Me
Me	2-Me-Ph	4-F
Me	3-Me-Ph	4-MeO
Me	3-Me-Ph	4-Cl
Me	3-Me-Ph	4-Me
Me	3-Me-Ph	6-Me
Me	3-Me-Ph	4-F
Me	3-Me-Ph	4-MeO
Me	4-Me-Ph	4-Cl
Me	4-Me-Ph	4-Me
Me	4-Me-Ph	6-Me
Me	4-Me-Ph	4-F
Me	4-Me-Ph	4-MeO
Me	4-Me-Ph	4-Bt
Me	2-F-Ph	4-Cl
Me	2-F-Ph	4-Me
Me	2-F-Ph	6-Me
Me	2-F-Ph	4-F
Me	2-F-Ph	4-MeO
Me	2-F-Ph	4-Bt
Me	3-F-Ph	4-Cl
Me	3-F-Ph	4-Me
Me	3-F-Ph	6-Me
Me	3-F-Ph	4-F
Me	3-F-Ph	4-MeO
Me	4-F-Ph	4-Cl
Me	4-F-Ph	4-Me
Me	4-F-Ph	6-Me
Me	4-F-Ph	4-F
Me	4-F-Ph	4-MeO
Me	4-F-Ph	4-Cl
Me	4-F-Ph	4-Me
Me	4-F-Ph	6-Me
Me	4-F-Ph	4-F
Me	4-F-Ph	4-MeO
Me	4-F-Ph	4-Et
Me	4-F-Ph	4-Cl
Me	2-MeO-Ph	4-Me
Me	2-MeO-Ph	6-Me
Me	2-MeO-Ph	4-F
Me	2-MeO-Ph	4-MeO
Me	3-MeO-Ph	4-Cl
Me	3-MeO-Ph	4-Me
Me	3-MeO-Ph	6-Me
Me	3-MeO-Ph	4-F
Me	3-MeO-Ph	4-MeO
Me	4-MeO-Ph	4-Cl
Me	4-MeO-Ph	4-Me
Me	4-MeO-Ph	6-Me
Me	4-MeO-Ph	4-F
Me	4-MeO-Ph	4-MeO
Me	4-MeO-Ph	4-Cl
Me	2-Br-Ph	4-Me
Me	2-Br-Ph	4-Cl

Me	2-Br-Ph	6-Me
Me	2-Br-Ph	4-F
Me	2-Br-Ph	4-MeO
Me	3-Br-Ph	4-Cl
Me	3-Br-Ph	4-Me
Me	3-Br-Ph	4-F
Me	3-Br-Ph	4-MeO
Me	4-Br-Ph	4-Cl
Me	4-Br-Ph	4-Me
Me	4-Br-Ph	4-F
Me	4-Br-Ph	4-MeO
Me	4-Et-Ph	4-Cl
Me	4-Et-Ph	4-Me
Me	4-Et-Ph	4-F
Me	4-Et-Ph	4-MeO
Me	2, 6-F ₂ -Ph	4-Cl
Me	2, 6-F ₂ -Ph	4-Me
Me	2, 6-F ₂ -Ph	6-Me
Me	2, 6-F ₂ -Ph	4-F
Me	2, 6-F ₂ -Ph	4-MeO
Me	2, 6-F ₂ -Ph	4-t-Bu
Me	2, 6-F ₂ -Ph	4-Et
Me	2, 6-F ₂ -Ph	4-COOMe
Me	2, 5-F ₂ -Ph	4-Cl
Me	2, 5-F ₂ -Ph	4-Me
Me	2, 5-F ₂ -Ph	6-Me
Me	2, 5-F ₂ -Ph	4-F
Me	2, 5-F ₂ -Ph	4-MeO
Me	2, 5-F ₂ -Ph	4-Et
Me	2, 4-F ₂ -Ph	4-Cl
Me	2, 4-F ₂ -Ph	4-Me
Me	2, 4-F ₂ -Ph	6-Me
Me	2, 4-F ₂ -Ph	4-F
Me	2, 4-F ₂ -Ph	4-MeO
Me	2, 4-F ₂ -Ph	4-Et
Me	2, 3-F ₂ -Ph	4-Cl
Me	2, 3-F ₂ -Ph	4-Me
Me	2, 3-F ₂ -Ph	6-Me
Me	2, 3-F ₂ -Ph	4-F
Me	2, 3-F ₂ -Ph	4-MeO
Me	2, 3-F ₂ -Ph	4-Et
Me	2, 3-F ₂ -Ph	4-Cl
Me	3, 4-F ₂ -Ph	4-Me
Me	3, 4-F ₂ -Ph	6-Me
Me	3, 4-F ₂ -Ph	4-F
Me	3, 4-F ₂ -Ph	4-MeO
Me	3, 4-F ₂ -Ph	4-Et
Me	3, 5-F ₂ -Ph	4-Cl
Me	3, 5-F ₂ -Ph	4-Me
Me	3, 5-F ₂ -Ph	6-Me
Me	3, 5-F ₂ -Ph	4-F
Me	3, 5-F ₂ -Ph	4-MeO
Me	3, 5-F ₂ -Ph	4-Et
Me	2-F-4-Me-Ph	4-Cl
Me	2-F-4-Me-Ph	4-Me
Me	2-F-4-Me-Ph	6-Me
Me	2-F-4-Me-Ph	4-F
Me	2-F-4-Me-Ph	4-MeO

Me	2-F-4-Me-Ph	4, 5-Me ₂
Me	2-F-4-Me-Ph	4, 6-Me ₂
Me	2-F-4-Me-Ph	4, 5-(MeO) ₂
Me	2-F-4-Me-Ph	4-t-Bu
Me	2-F-4-Me-Ph	4-Et
Me	2-F-4-Et-Ph	4-Cl
Me	2-F-4-Et-Ph	4-Me
Me	2-F-4-Et-Ph	6-Me
Me	2-F-4-Et-Ph	4-F
Me	2-F-4-Et-Ph	4-MeO
Me	2-F-4-Et-Ph	4-Et
Me	2-F-6-MeO-Ph	4-Cl
Me	2-F-6-MeO-Ph	4-Me
Me	2-F-6-MeO-Ph	6-Me
Me	2-F-6-MeO-Ph	4-F
Me	2-F-6-MeO-Ph	6-F
Me	2-F-6-MeO-Ph	4-MeO
Me	2, 6-Cl ₂ -Ph	4-Cl
Me	2, 6-Cl ₂ -Ph	4-Me
Me	2, 6-Cl ₂ -Ph	6-Me
Me	2, 6-Cl ₂ -Ph	4-F
Me	2, 6-Cl ₂ -Ph	4-MeO
Me	2, 6-Cl ₂ -Ph	4-Et
Me	2, 5-Cl ₂ -Ph	4-Cl
Me	2, 5-Cl ₂ -Ph	4-Me
Me	2, 5-Cl ₂ -Ph	4-F
Me	2, 5-Cl ₂ -Ph	4-MeO
Me	2, 4-Cl ₂ -Ph	4-Cl
Me	2, 4-Cl ₂ -Ph	4-Me
Me	2, 4-Cl ₂ -Ph	6-Me
Me	2, 4-Cl ₂ -Ph	4-F
Me	2, 4-Cl ₂ -Ph	4-MeO
Me	2, 4-Cl ₂ -Ph	4-Et
Me	2, 3-Cl ₂ -Ph	4-Cl
Me	2, 3-Cl ₂ -Ph	4-Me
Me	2, 3-Cl ₂ -Ph	6-Me
Me	2, 3-Cl ₂ -Ph	4-F
Me	2, 3-Cl ₂ -Ph	4-MeO
Me	3, 4-Cl ₂ -Ph	4-Cl
Me	3, 4-Cl ₂ -Ph	4-Me
Me	3, 4-Cl ₂ -Ph	4-F
Me	3, 4-Cl ₂ -Ph	4-MeO
Me	3, 5-Cl ₂ -Ph	4-Cl
Me	3, 5-Cl ₂ -Ph	4-Me
Me	3, 5-Cl ₂ -Ph	6-Me
Me	3, 5-Cl ₂ -Ph	4-F
Me	3, 5-Cl ₂ -Ph	4-MeO
Me	2, 6-Me ₂ -Ph	4-Cl
Me	2, 6-Me ₂ -Ph	4-Me
Me	2, 6-Me ₂ -Ph	4-F
Me	2, 6-Me ₂ -Ph	4-MeO
Me	2, 5-Me ₂ -Ph	4-Cl
Me	2, 5-Me ₂ -Ph	4-Me
Me	2, 5-Me ₂ -Ph	4-F
Me	2, 4-Me ₂ -Ph	4-MeO
Me	2, 4-Me ₂ -Ph	4-Cl
Me	2, 4-Me ₂ -Ph	4-Me
Me	2, 4-Me ₂ -Ph	4-F

Me	2, 4-Me ₂ -Ph	4-MeO
Me	2, 3-Me ₂ -Ph	4-Cl
Me	2, 3-Me ₂ -Ph	4-Me
Me	2, 3-Me ₂ -Ph	4-F
Me	2, 3-Me ₂ -Ph	4-MeO
Me	3, 4-Me ₂ -Ph	4-Cl
Me	3, 4-Me ₂ -Ph	4-Me
Me	3, 4-Me ₂ -Ph	4-F
Me	3, 5-Me ₂ -Ph	4-MeO
Me	3, 5-Me ₂ -Ph	4-Cl
Me	3, 5-Me ₂ -Ph	4-Me
Me	3, 5-Me ₂ -Ph	4-F
Et	Et	4-MeO
Et	n-Pr	H
Et	i-Pr	H
Et	n-Bu	H
Et	s-Bu	H
Et	t-Bu	H
Et	CF ₃	H
Et	CF ₂ CF ₃	H
Et	1-Naphthyl	H
Et	2-Naphthyl	H
Et	Ph	H
Et	2-Cl-Ph	H
Et	4-Cl-Ph	H
Et	2-F-Ph	H
Et	4-F-Ph	H
Et	2-Me-Ph	H
Et	3-Me-Ph	H
Et	4-Me-Ph	H
Et	2-MeO-Ph	H
Et	3-MeO-Ph	H
Et	4-MeO-Ph	H
Et	4-Br-Ph	H
Et	4-Ph-Ph	H
Et	4-PhO-Ph	H
Et	2, 3-F ₂ -Ph	H
Et	2, 5-F ₂ -Ph	H
Et	3, 4-F ₂ -Ph	H
Et	3, 5-F ₂ -Ph	H
Et	2, 4-F ₂ -Ph	H
Et	2-F-4-Cl-Ph	H
Et	2-F-4-Me-Ph	H
Et	2-F-4-MeO-Ph	H
Et	3-F-4-Cl-Ph	H
Et	3-F-4-Me-Ph	H
Et	3-F-4-MeO-Ph	H
Et	4-F-2-Cl-Ph	H
Et	4-F-2-Me-Ph	H
Et	4-F-2-MeO-Ph	H
Et	4-F-3-Cl-Ph	H
Et	4-F-3-Me-Ph	H
Et	4-F-3-MeO-Ph	H
Et	2, 6-(MeO) ₂ -Ph	H
Et	2-Br-Ph	H
Et	3-Br-Ph	H
Et	4-EtO-Ph	H

Et	2, 3-Me ₂ -Ph	H
Et	3, 4-Me ₂ -Ph	H
Et	3, 5-Me ₂ -Ph	H
Et	2-Cl-3-Me-Ph	H
Et	2-Cl-4-Me-Ph	H
Et	3-Cl-4-Me-Ph	H
Et	4-Cl-2-Me-Ph	H
Et	4-Cl-3-Me-Ph	H
Et	2, 4, 6-Me ₃ -Ph	H
Et	Ph	4-Cl
Et	Ph	4-Me
Et	Ph	6-Me
Et	Ph	4-F
Et	Ph	4-MeO
Et	Ph	4-t-Bu
Et	Ph	4-Et
Et	Ph	4-Cl
Et	2-Cl-Ph	4-Me
Et	2-Cl-Ph	6-Me
Et	2-Cl-Ph	4-F
Et	2-Cl-Ph	4-MeO
Et	2-Cl-Ph	4-t-Bu
Et	2-Cl-Ph	4-Et
Et	3-Cl-Ph	4-Cl
Et	3-Cl-Ph	4-Me
Et	3-Cl-Ph	6-Me
Et	3-Cl-Ph	4-F
Et	3-Cl-Ph	4-MeO
Et	4-Cl-Ph	4-Cl
Et	4-Cl-Ph	4-Me
Et	4-Cl-Ph	6-Me
Et	4-Cl-Ph	4-F
Et	4-Cl-Ph	4-MeO
Et	2-Me-Ph	4-Cl
Et	2-Me-Ph	4-Me
Et	2-Me-Ph	4-F
Et	2-Me-Ph	4-MeO
Et	3-Me-Ph	4-Cl
Et	3-Me-Ph	4-Me
Et	3-Me-Ph	6-Me
Et	3-Me-Ph	4-F
Et	3-Me-Ph	4-MeO
Et	4-Me-Ph	4-Cl
Et	4-Me-Ph	4-Me
Et	4-Me-Ph	6-Me
Et	4-Me-Ph	4-F
Et	4-Me-Ph	4-MeO
Et	4-Me-Ph	4-Et
Et	2-F-Ph	4-Cl
Et	2-F-Ph	4-Me
Et	2-F-Ph	6-Me
Et	2-F-Ph	4-F
Et	2-F-Ph	4-MeO
Et	2-F-Ph	4-Et
Et	3-F-Ph	4-Cl
Et	3-F-Ph	4-Me
Et	3-F-Ph	6-Me
Et	3-F-Ph	4-F

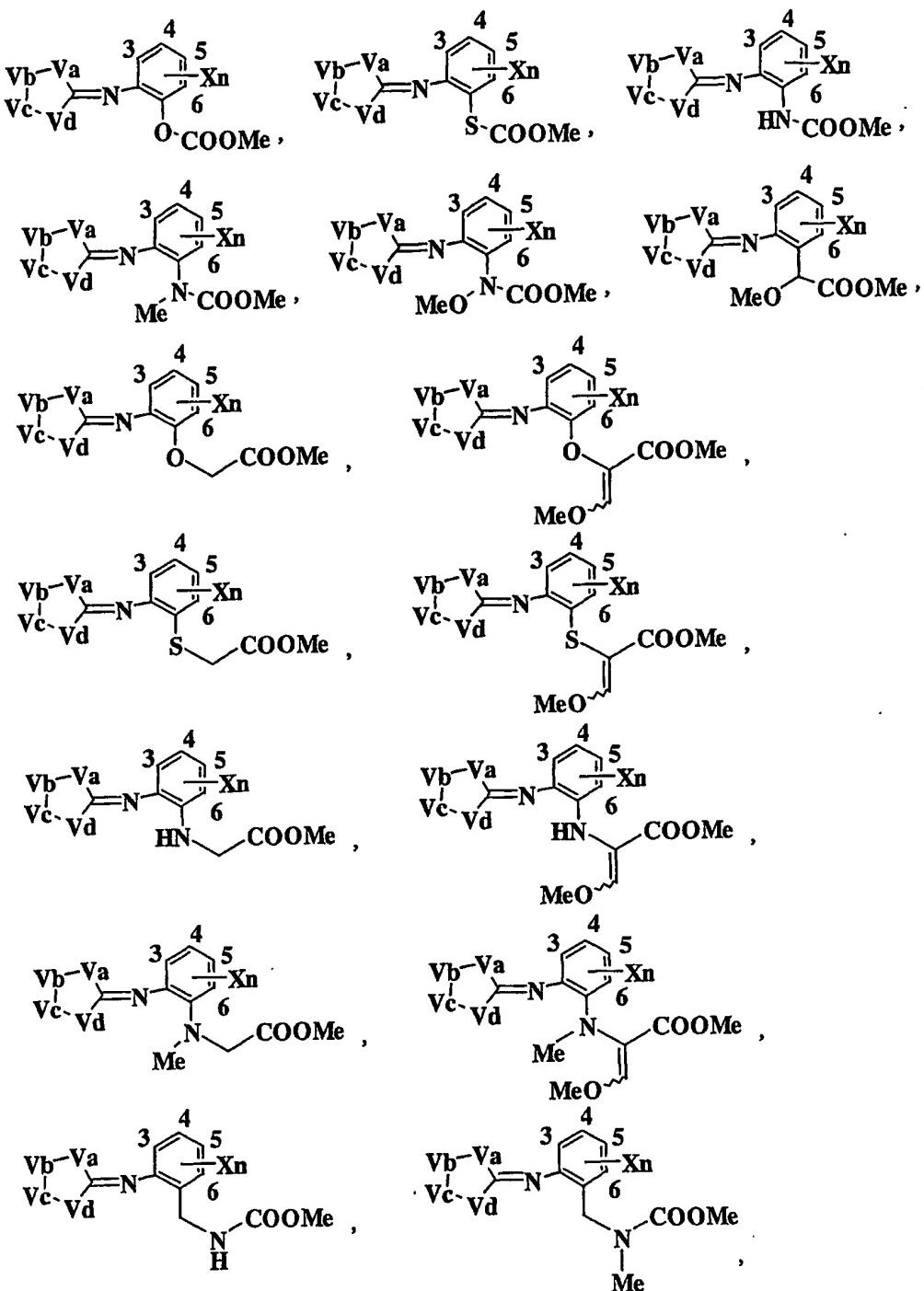
Et	3-F-Ph	4-MeO
Et	4-F-Ph	4-Cl
Et	4-F-Ph	4-Me
Et	4-F-Ph	6-Me
Et	4-F-Ph	4-F
Et	4-F-Ph	4-MeO
Et	4-F-Ph	4-Et
Et	4-F-Ph	4-Cl
Et	2-MeO-Ph	4-Me
Et	2-MeO-Ph	6-Me
Et	2-MeO-Ph	4-F
Et	2-MeO-Ph	4-MeO
Et	3-MeO-Ph	4-Cl
Et	3-MeO-Ph	4-Me
Et	3-MeO-Ph	6-Me
Et	3-MeO-Ph	4-F
Et	3-MeO-Ph	4-MeO
Et	4-MeO-Ph	4-Cl
Et	4-MeO-Ph	4-Me
Et	4-MeO-Ph	6-Me
Et	4-MeO-Ph	4-F
Et	4-MeO-Ph	4-MeO
Et	2-Br-Ph	4-Cl
Et	2-Br-Ph	4-Me
Et	2-Br-Ph	6-Me
Et	2-Br-Ph	4-F
Et	2-Br-Ph	4-MeO
Et	3-Br-Ph	4-Cl
Et	3-Br-Ph	4-Me
Et	3-Br-Ph	4-F
Et	3-Br-Ph	4-MeO
Et	4-Br-Ph	4-Cl
Et	4-Br-Ph	4-Me
Et	4-Br-Ph	4-F
Et	4-Br-Ph	4-MeO
Et	4-Et-Ph	4-Cl
Et	4-Et-Ph	4-Me
Et	4-Et-Ph	4-F
Et	4-Et-Ph	4-MeO
Et	2, 6-F ₂ -Ph	4-Cl
Et	2, 6-F ₂ -Ph	4-Me
Et	2, 6-F ₂ -Ph	6-Me
Et	2, 6-F ₂ -Ph	4-F
Et	2, 6-F ₂ -Ph	4-MeO
Et	2, 6-F ₂ -Ph	4-t-Bu
Et	2, 6-F ₂ -Ph	4-Et
Et	2, 6-F ₂ -Ph	4-COOMe
Et	2, 5-F ₂ -Ph	4-Cl
Et	2, 5-F ₂ -Ph	4-Me
Et	2, 5-F ₂ -Ph	6-Me
Et	2, 5-F ₂ -Ph	4-F
Et	2, 5-F ₂ -Ph	4-MeO
Et	2, 5-F ₂ -Ph	4-Et
Et	2, 5-F ₂ -Ph	4-Cl
Et	2, 4-F ₂ -Ph	4-Me
Et	2, 4-F ₂ -Ph	6-Me
Et	2, 4-F ₂ -Ph	4-F
Et	2, 4-F ₂ -Ph	4-MeO

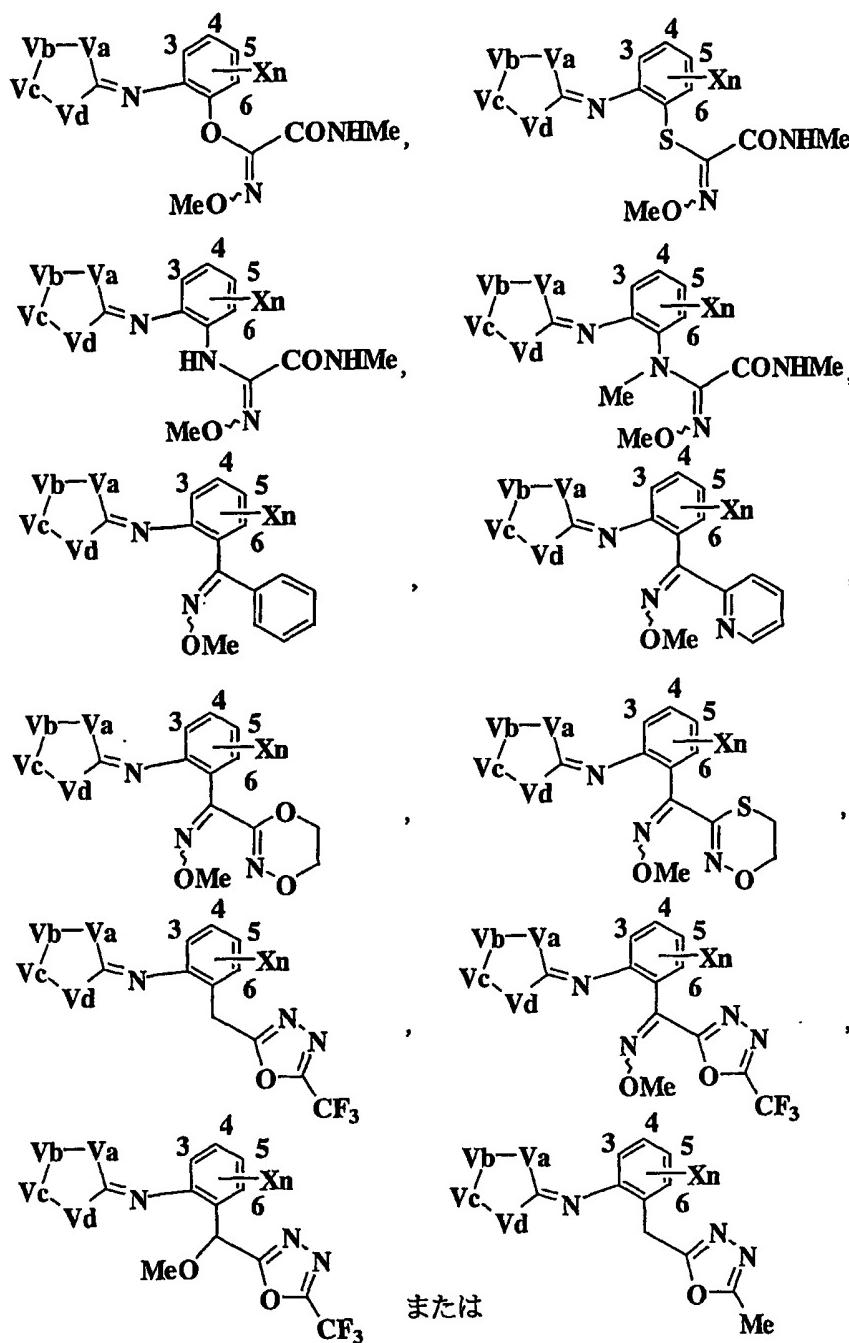
Et	2, 4-F ₂ -Ph	4-Et
Et	2, 3-F ₂ -Ph	4-Cl
Et	2, 3-F ₂ -Ph	4-Me
Et	2, 3-F ₂ -Ph	6-Me
Et	2, 3-F ₂ -Ph	4-F
Et	2, 3-F ₂ -Ph	4-MeO
Et	2, 3-F ₂ -Ph	4-Et
Et	3, 4-F ₂ -Ph	4-Cl
Et	3, 4-F ₂ -Ph	4-Me
Et	3, 4-F ₂ -Ph	6-Me
Et	3, 4-F ₂ -Ph	4-F
Et	3, 4-F ₂ -Ph	4-MeO
Et	3, 4-F ₂ -Ph	4-Et
Et	3, 4-F ₂ -Ph	4-Cl
Et	3, 5-F ₂ -Ph	4-Me
Et	3, 5-F ₂ -Ph	6-Me
Et	3, 5-F ₂ -Ph	4-F
Et	3, 5-F ₂ -Ph	4-MeO
Et	3, 5-F ₂ -Ph	4-Et
Et	2-F-4-Me-Ph	4-Cl
Et	2-F-4-Me-Ph	4-Me
Et	2-F-4-Me-Ph	6-Me
Et	2-F-4-Me-Ph	4-F
Et	2-F-4-Me-Ph	4-MeO
Et	2-F-4-Me-Ph	4, 5-Me ₂
Et	2-F-4-Me-Ph	4, 6-Me ₂
Et	2-F-4-Me-Ph	4, 5-(MeO) ₂
Et	2-F-4-Me-Ph	4-t-Bu
Et	2-F-4-Me-Ph	4-Et
Et	2-F-4-Et-Ph	4-Cl
Et	2-F-4-Et-Ph	4-Me
Et	2-F-4-Et-Ph	6-Me
Et	2-F-4-Et-Ph	4-F
Et	2-F-4-Et-Ph	4-MeO
Et	2-F-4-Et-Ph	4-Et
Et	2, 6-Cl ₂ -Ph	4-Cl
Et	2, 6-Cl ₂ -Ph	4-Me
Et	2, 6-Cl ₂ -Ph	6-Me
Et	2, 6-Cl ₂ -Ph	4-F
Et	2, 6-Cl ₂ -Ph	4-MeO
Et	2, 6-Cl ₂ -Ph	4-Et
Et	2, 6-Cl ₂ -Ph	4-Cl
Et	2, 5-Cl ₂ -Ph	4-Me
Et	2, 5-Cl ₂ -Ph	4-F
Et	2, 5-Cl ₂ -Ph	4-MeO
Et	2, 5-Cl ₂ -Ph	4-CI
Et	2, 4-Cl ₂ -Ph	4-Me
Et	2, 4-Cl ₂ -Ph	6-Me
Et	2, 4-Cl ₂ -Ph	4-F
Et	2, 4-Cl ₂ -Ph	4-MeO
Et	2, 4-Cl ₂ -Ph	4-Et
Et	2, 3-Cl ₂ -Ph	4-Cl
Et	2, 3-Cl ₂ -Ph	4-Me
Et	2, 3-Cl ₂ -Ph	6-Me
Et	2, 3-Cl ₂ -Ph	4-F
Et	2, 3-Cl ₂ -Ph	4-MeO
Et	2, 3-Cl ₂ -Ph	4-Cl
Et	3, 4-Cl ₂ -Ph	4-Me

Et	3, 4-Cl ₂ -Ph	4-F
Et	3, 4-Cl ₂ -Ph	4-MeO
Et	3, 5-Cl ₂ -Ph	4-Cl
Et	3, 5-Cl ₂ -Ph	4-Me
Et	3, 5-Cl ₂ -Ph	6-Me
Et	3, 5-Cl ₂ -Ph	4-F
Et	3, 5-Cl ₂ -Ph	4-MeO
Et	2, 6-Me ₂ -Ph	4-Cl
Et	2, 6-Me ₂ -Ph	4-Me
Et	2, 6-Me ₂ -Ph	4-F
Et	2, 6-Me ₂ -Ph	4-MeO
Et	2, 5-Me ₂ -Ph	4-Cl
Et	2, 5-Me ₂ -Ph	4-Me
Et	2, 5-Me ₂ -Ph	4-F
Et	2, 5-Me ₂ -Ph	4-MeO
Et	2, 4-Me ₂ -Ph	4-Cl
Et	2, 4-Me ₂ -Ph	4-Me
Et	2, 4-Me ₂ -Ph	4-F
Et	2, 4-Me ₂ -Ph	4-MeO
Et	2, 3-Me ₂ -Ph	4-Cl
Et	2, 3-Me ₂ -Ph	4-Me
Et	2, 3-Me ₂ -Ph	4-F
Et	2, 3-Me ₂ -Ph	4-MeO
Et	3, 4-Me ₂ -Ph	4-Cl
Et	3, 4-Me ₂ -Ph	4-Me
Et	3, 4-Me ₂ -Ph	4-F
Et	3, 4-Me ₂ -Ph	4-MeO
Et	3, 5-Me ₂ -Ph	4-Cl
Et	3, 5-Me ₂ -Ph	4-Me
Et	3, 5-Me ₂ -Ph	4-F
Et	3, 5-Me ₂ -Ph	4-MeO
Pr	Et	H
Pr	n-Pr	H
Pr	i-Pr	H
Pr	s-Bu	H
Pr	t-Bu	H
Pr	CF ₃	H
Pr	Ph	H
Pr	2-Cl-Ph	H
Pr	4-Cl-Ph	H
Pr	2-F-Ph	H
Pr	4-F-Ph	H
Pr	2-Me-Ph	H
Pr	4-Me-Ph	H
Pr	4-Br-Ph	H
Pr	2, 6-F ₂ -Ph	H
Pr	2, 3-F ₂ -Ph	H
Pr	2, 5-F ₂ -Ph	H
Pr	3, 4-F ₂ -Ph	H
Pr	3, 5-F ₂ -Ph	H
Pr	2, 4-F ₂ -Ph	H
Pr	2-Br-Ph	H
Br	n-Pr	H
Br	i-Pr	H
Br	s-Bu	H
Br	t-Bu	H
Br	CF ₃	H
Br	CF ₂ CF ₃	H

Br	Ph	H
Br	2-Cl-Ph	H
Br	4-Cl-Ph	H
Br	2-F-Ph	H
Br	4-F-Ph	H
Br	2-Me-Ph	H
Br	4-Me-Ph	H
Br	4-Br-Ph	H
i-Pr	i-Pr	H
i-Pr	s-Bu	H
i-Pr	t-Bu	H
i-Pr	CF ₃	H
i-Pr	CF ₂ CF ₃	H
i-Pr	Ph	H
i-Pr	2-Cl-Ph	H
i-Pr	4-Cl-Ph	H
i-Pr	2-F-Ph	H
i-Pr	4-F-Ph	H
i-Pr	2-Me-Ph	H
i-Pr	4-Me-Ph	H
i-Pr	4-Br-Ph	H
i-Pr	2-Br-Ph	H

〔第5表〕





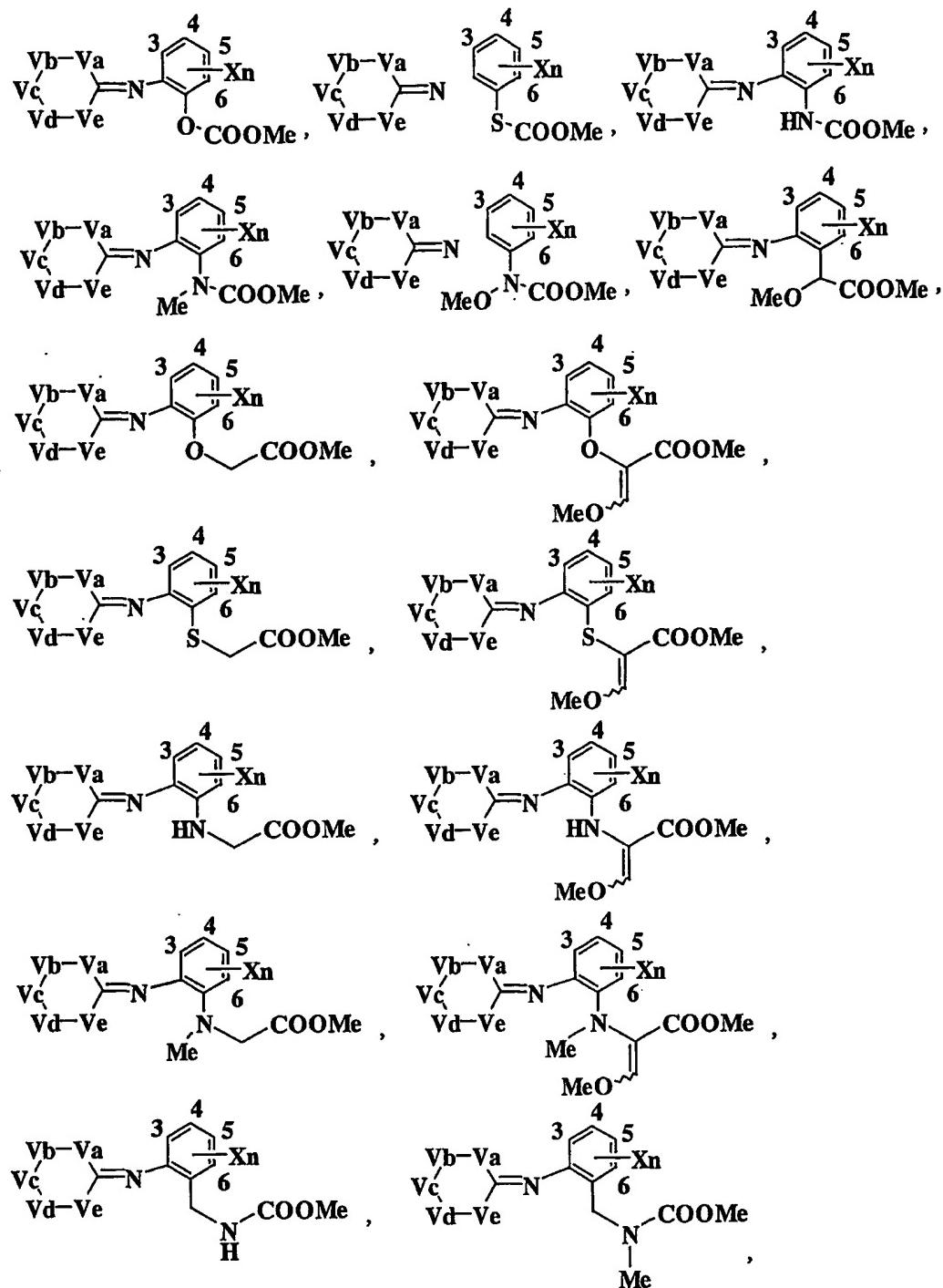
-Va-Vb-Vc-Vd-	X n
-S-CH ₂ -C(OH)(C ₂ F ₅)-N(Me)-	H
-S-CH(CH ₂ Br)-CH ₂ -N(Me)-	H
-S-S-CH=N-	H
-S-S-C(Ph)=N-	H

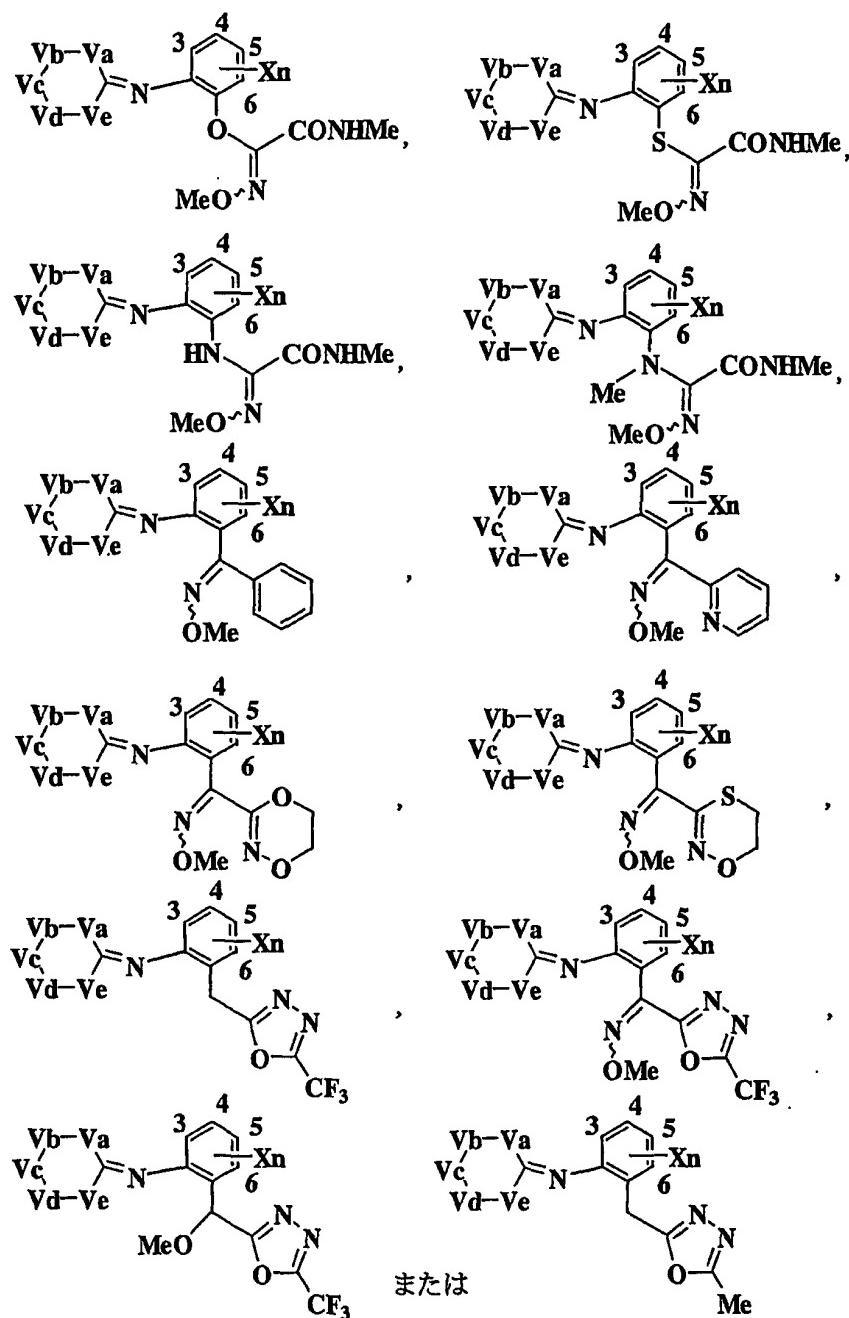
-S-S-C(CF ₃)=N-	H
-S-N(Me)-CH ₂ -S-	H
-S-N(Ph)-CH ₂ -S-	H
-S-N(Me)-CH(Ph)-S-	H
-N=N-C(=O)-O-	H
-N=N-CH(Me)-O-	H
-N=N-CH(Ph)-O-	H
-S-O-CH=N-	H
-S-O-C(Me)=N-	H
-S-O-C(Ph)=N-	H
-CH=CH-N(Me)-S-	H
-CH=CH-N(Ph)-S-	H
-C(Me)=CH-N(Ph)-S-	H
-CH=C(Me)-N(Ph)-S-	H
-C(Me)=C(Me)-N(Ph)-S-	H
-CH=CH-N(Me)-O-	H
-CH=CH-N(Ph)-O-	H
-C(Me)=CH-N(Ph)-O-	H
-CH=C(Me)-N(Ph)-O-	H
-C(Me)=C(Me)-N(Ph)-O-	H
-CH ₂ -CH ₂ -N(Me)-O-	H
-CH ₂ -CH ₂ -N(Ph)-O-	H
-CH ₂ -C(=O)-N(Ph)-O-	H
-CH=N-N(Me)-CH ₂ -	H
-CH=N-N(Ph)-CH ₂ -	H
-CH=N-N(Ph)-C(=O)-	H
-C(Me)=N-N(Ph)-C(=O)-	H
-N(Me)-CH ₂ -N(Ph)-O-	H
-N(Me)-C(=O)-N(Ph)-O-	H
-N(Me)-CH ₂ -N(Ph)-S-	H
-N(Me)-C(=O)-N(Ph)-S-	H
-S-CH ₂ -C(Ph)=N-	H
-S-CH ₂ -N(Ph)-N(Me)-	H
-S-C(=O)-N(Ph)-N(Me)-	H
-O-CH ₂ -C(Ph)=N-	H
-O-CH ₂ -N(Ph)-N(Me)-	H
-O-C(=O)-N(Ph)-N(Me)-	H
-S-CH(Ph)-N(Me)-N(Me)-	H
-O-CH(Ph)-N(Me)-N(Me)-	H
-N=C(Me)-N=N-	H
-N=C(Ph)-N=N-	H
-N=CH-CH=N-	H
-N=C(Ph)-CH=N-	H
-S-N(Me)-CH ₂ -N(Me)-	H
-S-N(Ph)-CH ₂ -N(Me)-	H
-O-N(Me)-CH ₂ -N(Me)-	H
-O-N(Ph)-CH ₂ -N(Me)-	H
-CH ₂ -CH ₂ -N(Me)-N(Me)-	H
-CH ₂ -CH ₂ -N(Ph)-N(Me)-	H
-CH ₂ -C(Ph)=N-N(Me)-	H
-CH=C(Ph)-N(Me)-N(Me)-	H
-CH=CH-N(Ph)-N(Me)-	H
-CH=C(Ph)-N=N-	H
-CH=N-C(Ph)=N-	H
-CH ₂ -CH ₂ -N=N-	H
-N(Me)-O-CH(Ph)-N(Me)-	H
-O-CH ₂ -C(Ph)=N-	H
-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -O-	H

-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -S-	H
-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(Me)-	H
-CH=CH-CH ₂ -O-	H
-CH=CH-CH ₂ -S-	H
-CH=CH-CH ₂ -N(Me)-	H
-CH ₂ -S-C(-N-Ph)-N(Me)-	H
-O-CH ₂ -CH ₂ -N(Me)-	H
-O-CH ₂ -CH(Ph)-N(Me)-	H
-O-CH=CH-N(Me)-	H
-O-CH=CH(Ph)-N(Me)-	H
-N(Me)-CH ₂ -CH ₂ -N(Me)-	H
-N(Me)-CH ₂ -CH(Ph)-N(Me)-	H
-N(Me)-CH=CH-N(Me)-	H
-N(Me)-CH=CH(Ph)-N(Me)-	H
-S-CH=N-N(Me)-	H
-S-C(Ph)=N-N(Me)-	H
-S-CH ₂ -N=N-	H
-S-CH(Ph)-N=N-	H
-O-CH=N-N(Me)-	H
-O-C(Ph)=N-N(Me)-	H
-N(Me)-CH ₂ -N(Me)-N(Me)-	H
-N(Me)-CH(Ph)-N(Me)-N(Me)-	H
-N(Me)-CH ₂ -N(Ph)-N(Me)-	H
-N(Me)-CH(Me)-N(Ph)-N(Me)-	H
-N(Me)-CH=N-N(Me)-	H
-N(Me)-C(Ph)=N-N(Me)-	H
-N(Me)-CH=N-N(Me)-	H
-N(Me)-CH=N-N(Me)-	H
-N=CH-N(Me)-N(Me)-	H
-N=C(Ph)-N(Me)-N(Me)-	H
-N=CH-N(Me)-N(Me)-	H
-N=CH-N(Ph)-N(Me)-	H
-S-N=CH-N(Me)-	H
-S-N=C(Ph)-N(Me)-	H
-S-N(Me)-CH=N-	H
-S-N(Ph)-C(Ph)=N-	H
-S-N(Me)-C(Ph)=N-	H
-S-N(Ph)-CH=N-	H
-O-N=CH-N(Me)-	H
-O-N=C(Ph)-N(Me)-	H
-O-N(Me)-CH=N-	H
-O-N(Ph)-C(Ph)=N-	H
-O-N(Me)-C(Ph)=N-	H
-O-N(Ph)-CH=N-	H
-N(Me)-O-CH=N-	H
-N(Ph)-O-C(Ph)=N-	H
-N(Me)-O-C(Ph)=N-	H
-N(Ph)-O-CH=N-	H
-N(Me)-CH ₂ -N=N-	H
-N(Me)-CH(Ph)-N=N-	H
-S-N=CH-S-	H
-S-N=C(Ph)-S-	H
-O-CH=CH-O-	H
-O-C(Me)=CH-O-	H
-O-C(Ph)=CH-O-	H
-O-C(Me)=C(Ph)-O-	H
-O-CH ₂ -CH ₂ -O-	H
-O-CH ₂ -CH(Ph)-O-	H

-O-CH(Ph)-CH(Me)-O-	H
-S-CH ₂ -CH ₂ -O-	H
-S-CH ₂ -CH(Ph)-O-	H
-S-CH(Ph)-CH(Me)-O-	H
-S-CH(Me)-CH(Ph)-O-	H
-S-CH(Ph)-CH ₂ -O-	H
-S-CH ₂ -CH ₂ -S-	H
-S-CH ₂ -CH(Ph)-S-	H
-S-CH(Ph)-CH(Me)-S-	H
-N(Me)-CH ₂ -CH ₂ -O-	H
-N(Me)-CH ₂ -CH(Ph)-O-	H
-N(Me)-CH(Ph)-CH(Me)-O-	H
-N(Me)-CH(Me)-CH(Ph)-O-	H
-N(Me)-CH(Ph)-CH ₂ -O-	H
-CH ₂ -N=CH-S-	H
-CH ₂ -N=C(Ph)-S-	H
-CH ₂ -S-CH=N-	H
-CH ₂ -S-C(Ph)=N-	H
-CH ₂ -N(Me)-CH ₂ -S-	H
-CH ₂ -N(Me)-CH(Ph)-S-	H
-CH ₂ -N(Ph)-CH ₂ -S-	H
-CH ₂ -N(Ph)-CH(Ph)-S-	H

〔第6表〕





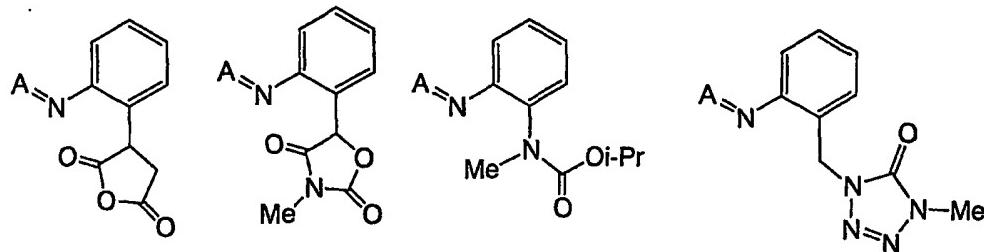
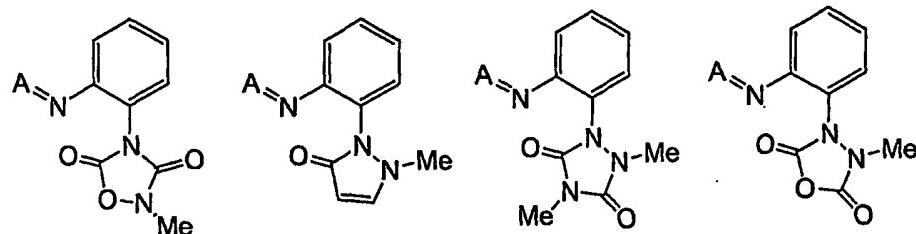
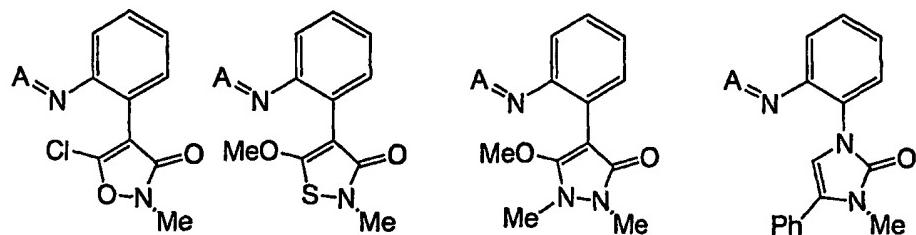
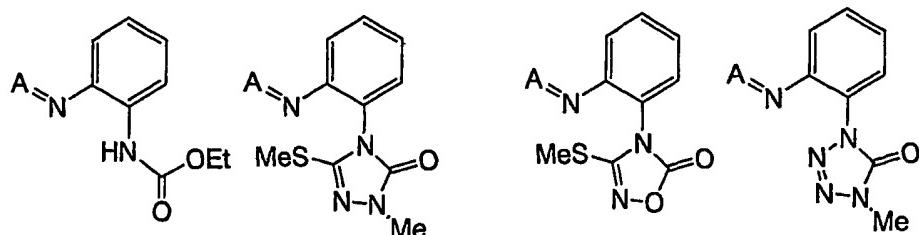
-Va-Vb-Vc-Vd-Ve-	X
-S-CH ₂ -CH=N-N(Me)-	H
-S-CH ₂ -CH=N-N(Ph)-	H
-S-CH ₂ -C(Me)=N-N(Me)-	H
-S-CH ₂ -C(Ph)=N-N(Me)-	H

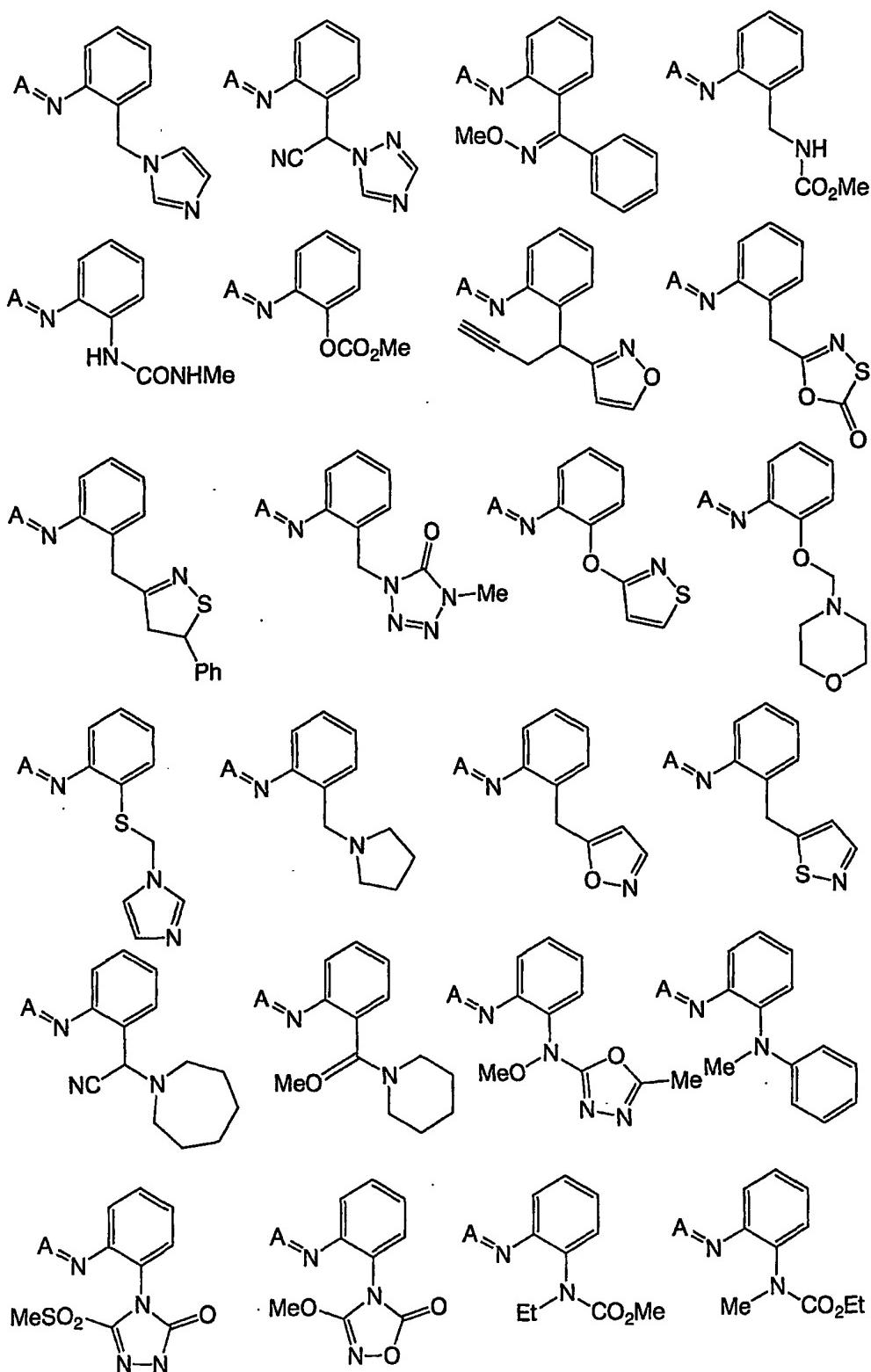
-S-C(=O)-CH ₂ -N(Me)-N(Me)-	H
-S-C(=O)-CH ₂ -N(Ph)-N(Me)-	H
-S-CH=C(Me)-N(Ph)-N(Me)-	H
-S-C(=O)-C(Me)=N-N(Me)-	H
-S-C(=O)-C(Ph)=N-N(Me)-	H
-CH ₂ -S-CH=CH-N(Me)-	H
-N=CH-N=C(F)-N(Me)-	H
-N=CH-N=C(Cl)-N(Me)-	H
-N=CH-N=C(Br)-N(Me)-	H
-N=CH-N=C(Ph)-N(Me)-	H
-N=CH-N=C(OPh)-N(Me)-	H
-N=CH-N=CH-N(Et)-	H
-N=CH-N=CH-N(Pr)-	H
-N=CH-N=C(CF ₃)-N(Me)-	H
-N=C(Cl)-N=CH-N(Me)-	H
-N=CH-N=CH-N(Me)-	H
-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -	H
-CH ₂ -CH ₂ -N(Me)-CH ₂ -CH ₂ -	H
-N(Me)-CH ₂ -CH=CH-S-	H
-N(Me)-CH ₂ -C(Ph)=CH-S-	H
-N(Me)-CH ₂ -CH=CH(Ph)-S-	H
-N(Me)-CH ₂ -CH=CH-O-	H
-N(Me)-CH ₂ -C(Ph)=CH-O-	H
-N(Me)-CH ₂ -CH=C(Ph)-O-	H
-N=CH-CH=CH-S-	H
-N=CH-C(Ph)=CH-S-	H
-N=CH-CH=C(Ph)-S-	H
-N=CH-CH=CH-O-	H
-N=CH-C(Ph)=CH-O-	H
-N=CH-CH=C(Ph)-O-	H
-S-CH ₂ -C(=O)-N(Me)-N(Me)-	H
-S-CH ₂ -C(=O)-NPh-N(Me)-	H
-S-CH=CH-CH(Ph)-N(Me)-	H
-CH=CH-CH=C(Ph)-N(-OMe)-	H
-CH=CH-CH=C(F)-N(-OMe)-	H
-CH=CH-CH=C(Cl)-N(-OMe)-	H
-CH=CH-CH=C(OPh)-N(-OMe)-	H
-N(Me)-CH ₂ -S-CH ₂ -N(Me)-	H
-N(Me)-CH ₂ -S-CH(Ph)-N(Me)-	H
-N(Me)-CH=CH-CH=N-	H
-N(Me)-C(Ph)=CH-CH=N-	H
-N(Me)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(Me)-	H
-N(Me)-CH(Ph)-CH ₂ -CH ₂ -N(Me)-	H
-O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(Me)-	H
-O-CH(Ph)-CH ₂ -CH ₂ -N(Me)-	H
-O-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(Me)-	H
-O-CH ₂ -CH ₂ -CH(Ph)-N(Me)-	H
-S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(Me)-	H
-S-CH(Ph)-CH ₂ -CH ₂ -N(Me)-	H
-S-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -N(Me)-	H
-S-CH ₂ -CH ₂ -CH(Ph)-N(Me)-	H
-N(Me)-CH ₂ -N(Me)-CH ₂ -N(Me)-	H
-N(Me)-CH ₂ -N(Me)-CH(Ph)-N(Me)-	H
-N(Me)-CH ₂ -O-CH ₂ -N(Me)-	H
-N(Me)-CH ₂ -O-CH(Ph)-N(Me)-	H
-S-CH ₂ -CH=CH ₂ -N(Me)-	H
-S-CH ₂ -CH=CH(Ph)-N(Me)-	H
-S-CH=CH ₂ -N(Me)-N(Me)-	H

-S-CH=CH₂-N(Ph)-N(Me)-

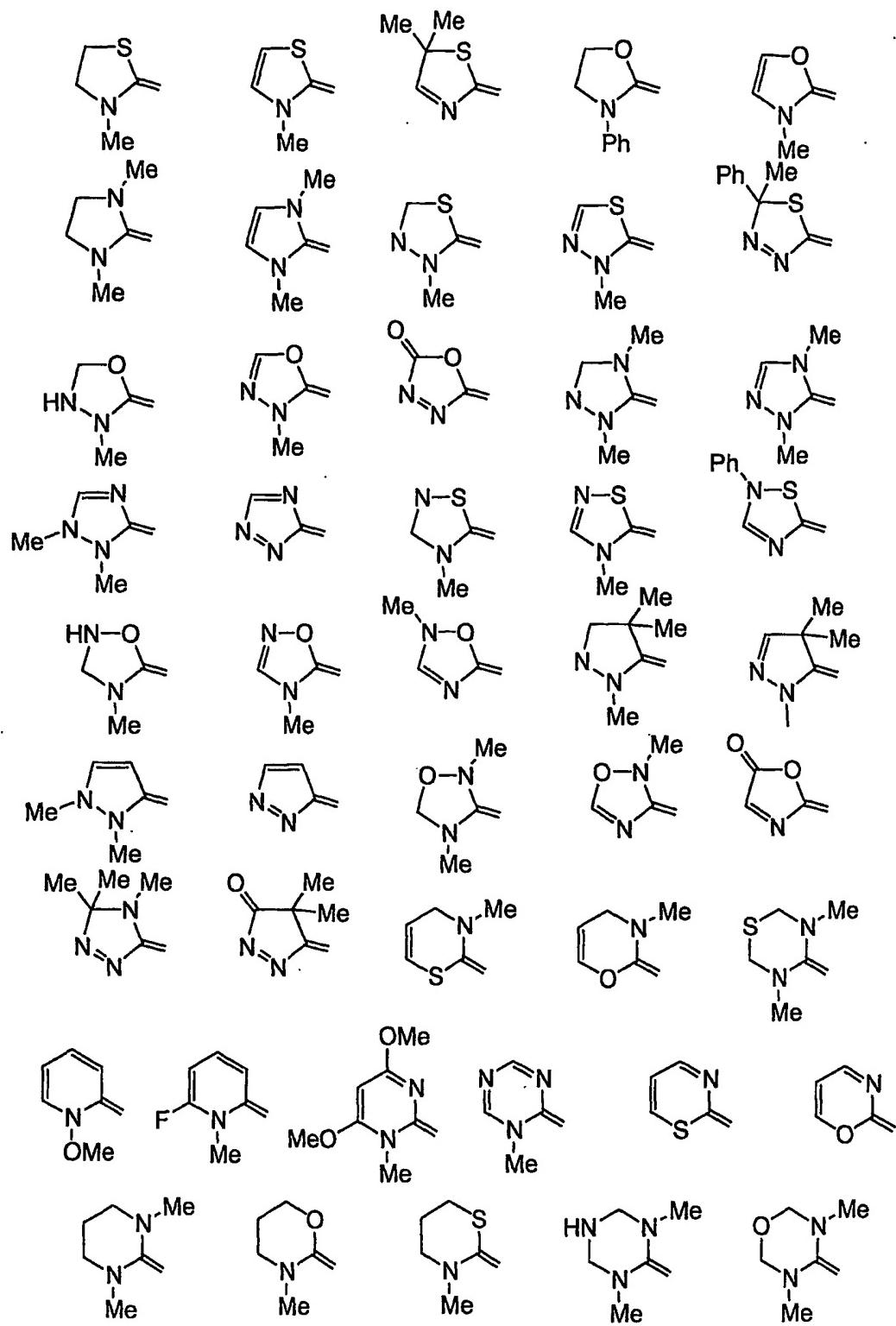
H

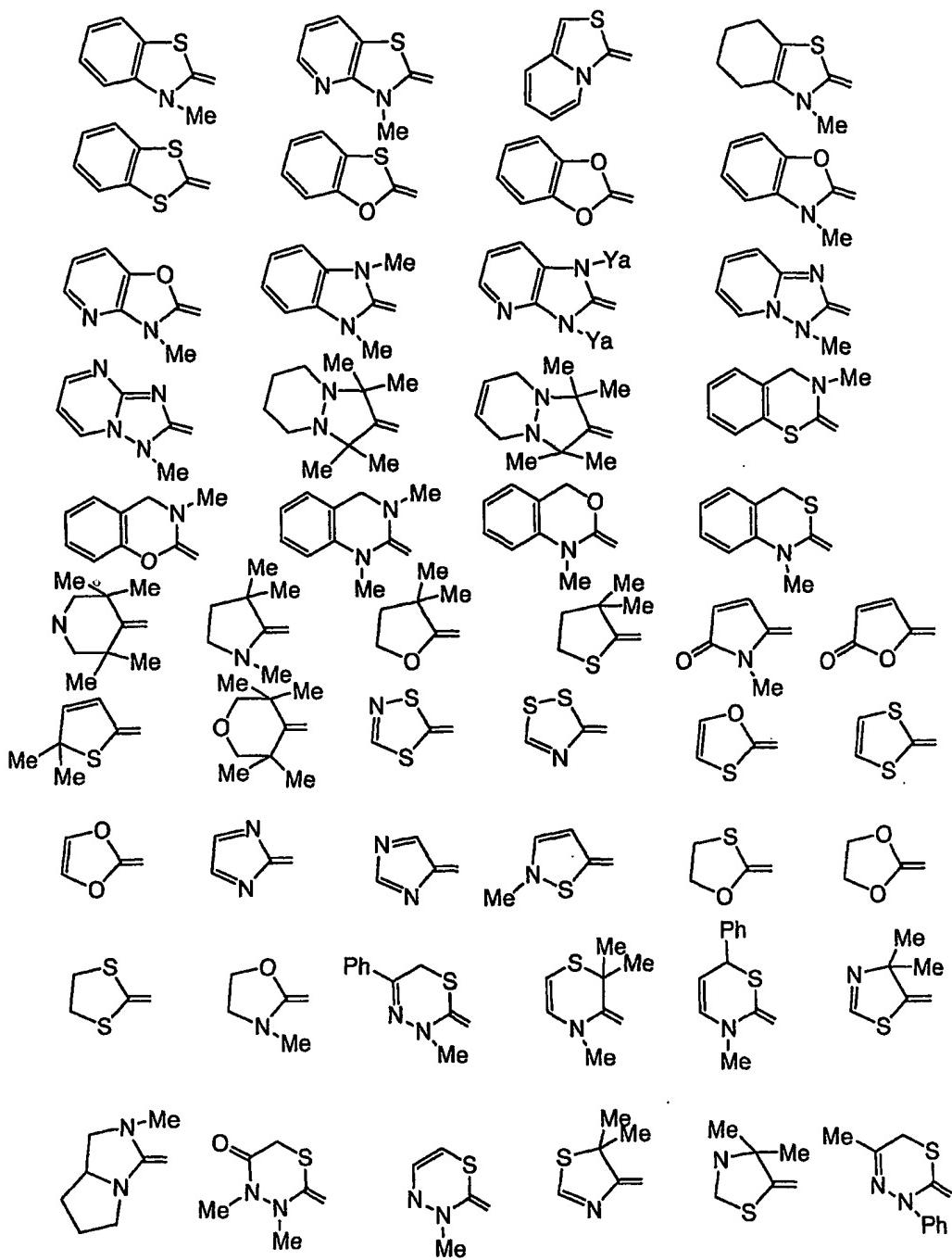
〔第7表〕





A





本発明化合物を植物病害および植物害虫防除剤として施用するにあたっては、通常適当な固体担体又は液体担体と混合し、更に所望により界面活性剤、浸透剤

、展着剤、増粘剤、凍結防止剤、結合剤、固結防止剤、崩壊剤および分解防止剤等を添加して、液剤 (soluble concentrate) 、乳剤 (emulsifiable concentrate) 、水和剤 (wettable powder) 、水溶剤 (water soluble powder) 、顆粒水和剤 (water dispersible granule) 、顆粒水溶剤 (water soluble granule) 、懸濁剤 (suspension concentrate) 、乳濁剤 (concentrated emulsion) 、サスボエマルジョン (suspoemulsion) 、マイクロエマルジョン (microemulsion) 、粉剤 (dustable powder) 、粒剤 (granule) およびゲル剤 (gel) 等任意の剤型の製剤にて実用に供することができる。また、省力化および安全性向上の観点から、上記任意の剤型の製剤を水溶性包装体に封入して供することもできる。

固体担体としては、例えば石英、カオリナイト、パイロフィライト、セリサイト、タルク、ペントナイト、酸性白土、アタパルジャイト、ゼオライトおよび珪藻土等の天然鉱物質類、炭酸カルシウム、硫酸アンモニウム、硫酸ナトリウムおよび塩化カリウム等の無機塩類、合成珪酸ならびに合成珪酸塩が挙げられる。

液体担体としては、例えばエチレングリコール、プロピレングリコールおよびイソプロパノール等のアルコール類、キシレン、アルキルベンゼンおよびアルキルナフタレン等の芳香族炭化水素類、ブチルセロソルブ等のエーテル類、シクロヘキサン等のケトン類、マーブチロラクトン等のエステル類、N-メチルピロリドン、N-オクチルピロリドン等の酸アミド類、大豆油、ナタネ油、綿実油およびヒマシ油等の植物油ならびに水が挙げられる。

これら固体および液体担体は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

界面活性剤としては、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックコポリマー、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ソルビタン脂肪酸エステルおよびポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル等のノニオン性界面活性剤、アルキル硫酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルスルホハク酸塩、ナフタレンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、アルキルナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸および磷酸塩、

ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル硫酸および燐酸塩、ポリカルボン酸塩およびポリスチレンスルホン酸塩等のアニオン性界面活性剤、アルキルアミン塩およびアルキル4級アンモニウム塩等のカチオン性界面活性剤ならびにアミノ酸型およびベタイン型等の両性界面活性剤が挙げられる。

これら界面活性剤の含有量は、特に限定されるものではないが、本発明の製剤100重量部に対し、通常0.05～20重量部の範囲が望ましい。また、これら界面活性剤は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

また、本発明化合物を農薬として使用する場合には必要に応じて製剤時または散布時に他種の除草剤、各種殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、植物生長調節剤、共力剤、肥料、土壤改良剤等と混合施用してもよい。

特に他の農薬あるいは植物ホルモンと混合施用することにより、施用薬量の減少による低コスト化、混合薬剤の相乗作用による殺菌殺虫スペクトラムの拡大や、より高い有害生物防除効果が期待できる。この際、同時に複数の公知農薬との組み合わせも可能である。本発明化合物と混合使用する農薬の種類としては、例えば、ファーム・ケミカルズ・ハンドブック (Farm Chemicals Handbook) 1999年版に記載されている化合物等がある。具体的にその一般名を例示すれば次の通りであるが、必ずしもこれらのみに限定されるものではない。

殺菌剤：アシベンゾラール (acibenzolar)、アムプロビルホス (ampropyfos)、アニラジン (anilazine)、アザコナゾール (azaconazole)、アゾキシストロビン (azoxystrobin)、ベナラキシリ (benalaxyl)、ベノダニル (benodanil)、ベノミル (benomyl)、ベンザマクリル (benzamacril)、ビナパクリル (binapacryl)、ビフェニル (biphenyl)、ビテルタノール (bitertanol)、ペトキサジン (bethoxazine)、ボルドー液 (bordeaux mixture)、プラストサイシン-S (blasticidin-S)、ブロモコナゾール (bromoconazole)、ブピリメート (bupirimate)、ブチオベート (buthiobate)、カルシウムポリスルフィド (calcium polysulfide)、キャプタフォール (captafol)、キャプタン (captan)、カッパーオキシクロリド (copper oxychloride)、カルプロパミド (carpropamid)、カルベンダジン (carbendazim)、カルボキシン (carbox

in)、キノメチオネート(chinomethionat)、クロベンチアゾン(chlobenthiazone)、クロルフェナゾール(chlorfenazol)、クロロネブ(chloroneb)、クロタロニル(chlorothalonil)、クロゾリネート(chlozolineate)、クフラネブ(cufraneb)、

シモキサニル(cymoxanil)、シプロコナゾール(cyproconazole)、シプロジニル(cyprodinil)、シプロフラム(cyprofuram)、デバカルブ(debacarb)、ジクロロフェン(dichlorophen)、ジクロブトラゾール(diclobutrazol)、ジクロフラニド(diclofluanid)、ジクロメジン(dicomedine)、ジクロラン(dicloran)、ジエトフェンカルブ(diethofencarb)、ジクロシメット(diclocymet)、ジフェノコナゾール(difenoconazole)、ジフルメトリン(diflumetorim)、ジメチリモール(dimethirimol)、

ジメトモルフ(dimethomorph)、ジニコナゾール(diniconazole)、ジニコナゾール-M(diniconazole-M)、ジノカップ(dinocap)、ジフェニルアミン(diphenylamine)、ジピリチオン(dipyrithione)、ジタリムホス(ditalimfos)、ジチアノン(dithianon)、ドデモルフ(dodemorph)、ドジン(dodine)、ドラゾクソロン(drazoxolon)、エデフェノホス(edifenphos)、エポキシコナゾール(epoxiconazole)、エタコナゾール(etaconazole)、エチリモル(ethirimol)、エトリジアゾール(etridiazole)、ファモキサドン(famoxadone)、フェナリモル(fenarimol)、フェブコナゾール(februconazole)、フェンフラン(fenfuram)、フェンピクロニル(fenpiclonil)、フェンプロピジン(fenpropidin)、フェンプロピモルフ(fenpropimorph)、フェンチン(fentin)、フェルバン(ferbam)、フェリムゾン(ferimzone)、フルアジナム(fluazinam)、フルジオキソニル(fludioxonil)、フルオロイミド(fluoroimide)、フルキンコナゾール(fluquinconazole)、フルシラゾール(flusilazole)、フルスルファミド(flusulfamide)、フルトラニル(flutolanil)、フルトリアフォール(flutriafol)、フォルペット(folpet)、フォセチルーアルミニウム(fosetyl-aluminium)、フベリダゾール(fuberidazole)、フララキシル(furalaxyd)、フェナミドン(fenamidone)、フェンヘキサミド(fenhexamid)、

グアザチン(guazatine)、ヘキサクロロベンゼン(hexachlorobenzene)、ヘ

キサコナゾール (hexaconazole) 、ヒメキサゾール (hymexazol) 、イマザリル (imazalil) 、イミベンコンゾール (imibenconazole) 、イミノクタジン (imin octadine) 、イプロコンゾール (ipconazole) 、イプロベンホス (iprobenfos) 、イプロジョン (iprodione) 、イソプロロチオラン (isoprothiolane) 、イプロバリカルブ (iprovalicarb) 、カスガマイシン (kasugamycin) 、クレソキシムメチル (kresoxim-methyl) 、マンカッパー (mancopper) 、マンコゼブ (mancozeb) 、マンネブ (maneb) 、メパンピリム (mepanipyrim) 、メプロニル (mepronil) 、メタラキシル (metalaxyl) 、メトコナゾール (metconazole) 、メチラム (metiram) 、メトミノストロビン (metominostrobin) 、ミクロブタニル (mycl obutanol) 、ナバム (nabam) 、ニッケルビス (ジメチルジチオカーバメート) (nickel bis(dimethyldithiocarbamate)) 、ニトロタールーイソプロピル (nit rothal-isopropyl) 、ヌアリモル (nuarimol) 、オクチリノン (octhilinone) 、オフレース (ofurace) 、オキサジキシル (oxadixyl) 、オキシカルボキシン (oxycarboxin) 、オキポコナゾールフマール酸塩 (oxoconazole fumarate) 、ペフラゾエート (pefurzoate) 、ペンコンゾール (penconazole) 、ペンシクロペフラゾエート (pencycuron) 、フタライド (phthalide) 、ピペラリン (piperalin) 、ボリオキシン (polyoxins) 、プロベナゾール (probenazole) 、プロクロラズ (proc hloraz) 、プロシミドン (procymidone) 、プロパモカルブ塩酸塩 (propamocarb hydrochloride) 、プロピコナゾール (propiconazole) 、プロピネブ (propine b) 、ピラゾホス (pyrazophos) 、ピリフェノックス (pyrifenoxy) 、ピリメタニル (pyrimethanil) 、ピロキュロン (pyroquilon) 、キノキシフェン (quinoxifen) 、キントゼン (quintozene) 、硫黄 (sulfur) 、スピロキサミン (spiroxamine) 、テブコナゾール (tebuconazole) 、テクナゼン (tecnazene) 、テトラコナゾール (tetraconazole) 、チアベンダゾール (thiabendazole) 、チフルザミド (thifluzamide) 、チオファネートメチル (thiophanate-methyl) 、チラム (thiram) 、トルクロホスメチル (tolclofos-methyl) 、トリルフラン (tr iylfluanid) 、トリアジメホン (triadimefon) 、トリアジメノール (toriadime nol) 、トリアゾキシド (triazoxide) 、トリシクラゾール (tricyclazole) 、トリデモルフ (tridemorph) 、トリフルミゾール (triflumizole) 、トリホリン

(triforine)、トリチコナゾール (triticonazole)、バリダマイシン (validamycin)、ビンクロゾリン (vinclozolin)、ジネブ (zineb) 及びジラム (ziram) 等。

殺バクテリア剤：ストレプトマイシン (streptomycin)、オキシテトラサイクリン (oxytetracycline) 及びオキソリニックアシド (oxolinic acid) 等。

殺線虫剤：アルドキシカルブ (aldoxycarb)、フォスチアゼート (fosthiazate)、フォスチエタン (fosthietan)、オキサミル (oxamyl) 及びフェナミホス (fenamiphos) 等。

殺ダニ剤：アミトラズ (amitraz)、ブロモプロピレート (bromopropylate)、チノメチオネート (chinomethionat)、クロロベンジラート (chlorobezilate)、クロフェンテジン (clofentezine)、サイヘキサチン (cyhexatin)、ジコフォール (dicofol)、ジエノクロール (dienochlor)、エトキサゾール (etoxazole)、フェナザキン (fenazaquin)、フェンブタチンオキシド (fenbutatin oxide)、フェンプロパトリン (fenpropothrin)、フェンプロキシメート (fenproximate)、ハルフェンプロックス (halfenprox)、ヘキシチアゾックス (hexythiazox)、ミルベメクチン (milbemectin)、プロバルギット (propargite)、ピリダベン (pyridaben)、ピリミジafen (pyrimidifen) 及びテブフェンピラド (tebufenpyrad) 等。

殺虫剤：アバメクチン (abamectin)、アセフェート (acephate)、アセタミピリド (acetamiprid)、アジンホスメチル (azinphos-methyl)、ベンジオカルブ (bendiocarb)、ベンフラカルブ (benfuracarb)、ベンスルタップ (bensultap)、ビフェントリン (bifenthrin)、ブuproフェジン (buprofezin)、ブトカルボキシン (butocarboxim)、カルバリル (carbaryl)、カルボフラン (carbofuran)、カルボスルファン (carbosulfan)、カルタップ (cartap)、クロルフェナビル (chlorfenapyr)、クロルピリホス (chlorpyrifos)、クロルフェンビンホス (chlorgenvinphos)、クロルフルアズロン (chlorfluazuron)、クロチアニジン (clothianidin)、クロマフェノジド (chromafenozyde)、クロピリホスメチル (chlorpyrifos-methyl)、サイフルトリリン (cyfluthrin)、ベーターサイフルトリリン (beta-cyfluthrin)、サイパームスリン (cypermethrin)

)、シロマジン (cyromazine)、サイハロトリン (cyhalothrin)、ラムダーシハロトリン (lambda-cyhalothrin)、デルタメトリン (deltamethrin)、ジアフエンチウロン (diafenthiuron)、ダイアジノン (diazinon)、ジアクロデン (diacloden)、ジフルベンズロン (diflubenzuron)、ジメチルビンホス (dimethylvinphos)、ジオフェノラン (diofenolan)、ジスルフォトン (disulfoton)、ジメトエート (dimethoate)、EPN、エスフェンバレレート (esfenvalerate)、エチオフェンカルブ (ethiofencarb)、エチプロール (ethiprole)、エトフェンプロックス (etofenprox)、エトリムホス (etrimfos)、フェニトロチオン (fenitrothion)、フェノブカルブ (fenobucarb)、フェノキシカーブ (fenoxy carb)、フェンプロパトリン (fenpropatrin)、フェンバレレート (fenvalerate)、フィプロニル (fipronil)、フルサイスリネート (flucythrinate)、フルフェノクスウロン (flufenoxuron)、フルフェンプロックス (flufenprox)、タウフルバリネート (tau-fluvalinate)、ホノホス (fonophos)、フォルメタネット (formetanate)、フォルモチオン (formothion)、フラチオカルブ (furathiocarb)、ハロフェノジド (halofenozide)、ヘキサフルムロン (hexaflumuron)、ヒドラメチルノン (hydramethylnon)、イミダクロプリド (imidacloprid)、イソフェンホス (isofenphos)、インドキサカルブ (indoxacarb)、イソプロカルブ (isoprocarb)、イソキサチオン (isoxathion)、ルフェヌウロン (lufenuron)、マラチオン (malathion)、メタルデヒド (metaldehyde)、メタミドホス (methamidophos)、メチダチオン (methidathion)、メタクリホス (methacrifos)、メタルカルブ (metalcarb)、メソミル (methomyl)、メソプレン (methoprene)、メトキシクロール (methoxychlor)、メトキシフェノジド (methoxyfenozide)、モノクロトホス (monocrotophos)、ムスカルーレ (muscalure)、ニテンピラム (nitenpyram)、オメトエート (omethoate)、オキシデメトニーメチル (oxydemeton-methyl)、オキサミル (oxamyl)、パラチオン (parathion)、パラチオニーメチル (parathion-methyl)、ペーメスリン (permethrin)、フェントエート (phentoate)、フォキシム (phoxim)、ホレート (phorate)、ホサロン (phosalone)、ホスマット (phosmet)、ホスファミドン (phosphamidon)、ピリミカルブ (pirimicarb)、ピリミホスメチル (pirimiphos-

methyl)、プロフェノホス (profenofos)、ピメトロジン (pymetrozin)、ピラクロホス (pyraclofos)、ピリプロキシフェン (pyriproxyfen)、ロテノン (rotenone)、スルプロホス (sulprofos)、シラフルオフェン (silaflufen)、スピノサド (spinosad)、スルホテップ (sulfotep)、テブフェノジド (tebfen ozide)、テフルベンズロン (teflubenzuron)、テフルトリン (tefluthrin)、テルブホス (terbufos)、テトラクロロビンホス (tetrachlorvinphos)、チオジカルブ (thiodicarb)、チアメトキサム (thiamethoxam)、チオファノックス (thiofanox)、チオメトン (thiometon)、トルフェンピラド (tolfenpyrad)、トラロメスリン (tralomethrin)、トリクロルホン (trichlorfon)、トリアズロン (triazuron)、トリフルムロン (triflumuron) 及びバミドチオン (vamidothion) 等。

本発明化合物の施用薬量は適用場面、施用時期、施用方法、栽培作物等により差異はあるが一般には有効成分量としてヘクタール (ha) 当たり 0.005~50 kg 程度が適當である。

次に本発明化合物を用いる場合の製剤の配合例を示す。但し本発明の配合例は、これらのみに限定されるものではない。なお、以下の配合例において「部」は重量部を意味する。

[水和剤]

本発明化合物	0.1~80 部
固体担体	5~98.9 部
界面活性剤	1~10 部
その他	0~5 部

その他として、例えば固結防止剤、分解防止剤等があげられる。

[乳 剤]

本発明化合物	0.1~30 部
液体担体	45~95 部
界面活性剤	4.9~15 部
その他	0~10 部

その他として、例えば展着剤、分解防止剤等が挙げられる。

〔懸濁剤〕

本発明化合物	0.1～70部
液体担体	15～98.89部
界面活性剤	1～12部
その他	0.01～30部

その他として、例えば凍結防止剤、増粘剤等が挙げられる。

〔顆粒水和剤〕

本発明化合物	0.1～90部
固体担体	0～98.9部
界面活性剤	1～20部
その他	0～10部

その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられる。

〔液 剤〕

本発明化合物	0.01～70部
液体担体	20～99.99部
その他	0～10部

その他として、例えば凍結防止剤、展着剤等が挙げられる。

〔粒 剤〕

本発明化合物	0.01～80部
固体担体	10～99.99部
その他	0～10部

その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられる。

〔粉 剤〕

本発明化合物	0.01～30部
固体担体	65～99.99部
その他	0～5部

その他として、例えばドリフト防止剤、分解防止剤等が挙げられる。

使用に際しては上記製剤を水で1～10000倍に希釈してまたは希釈せずに散布する。

次に、本発明化合物を有効成分とする農園芸用殺菌殺虫剤の製剤例を具体的に示すが、これらのみに限定されるものではない。なお、以下の製剤例において「部」は重量部を意味する。

〔製剤例 1〕 乳剤

本発明化合物No. I-1	20部
メチルナフタレン	55部
シクロヘキサン	20部
ソルホール 2680	5部

(非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業（株）商品名)

以下を均一に混合して乳剤とする。使用に際しては上記乳剤を50～20000倍に希釈して有効成分量がヘクタール当たり0.005～50kgになるように散布する。

〔製剤例 2〕 水和剤

本発明化合物No. I-37	25部
パイロフィライト	66部
ソルホール 5039	4部

(アニオン性界面活性剤：東邦化学工業（株）商品名)

カーブレックス #80D	3部
--------------	----

(ホワイトカーボン：塩野義製薬（株）商品名)

リグニンスルホン酸カルシウム	2部
----------------	----

以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。

使用に際しては上記水和剤を50～20000倍に希釈して有効成分量がヘクタール当たり0.005～50kgになるように散布する。

〔製剤例 3〕 粉剤

本発明化合物No. I-43	3部
カーブレックス #80D	0.5部
(ホワイトカーボン：塩野義製薬（株）商品名)	

カオリナイト	95部
--------	-----

リン酸ジイソプロピル 1. 5部

以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。使用に際して上記粉剤を有効成分量がヘクタール当たり 0. 005~50 kg になるように散布する。

〔製剤例 4〕 粒剤

本発明化合物 No. I-53	5 部
ペントナイト	30 部
タルク	64 部
リグニンスルホン酸カルシウム	1 部

以上を均一に混合粉碎して少量の水を加えて攪拌混合し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して粒剤とする。使用に際して上記粒剤を有効成分量がヘクタール当たり 0. 005~50 kg になるように散布する。

〔製剤例 5〕 懸濁剤

本発明化合物 No. I-70	25 部
ソルポール 3353	5 部

(非イオン性界面活性剤：東邦化学工業（株）商品名)

ルノックス 1000C	0. 5 部
-------------	--------

(陰イオン性界面活性剤：東邦化学工業（株）商品名)

ザンサンガム（天然高分子）	0. 2 部
安息香酸ソーダ	0. 4 部
プロピレングリコール	10 部
水	58. 9 部

有効成分（本発明化合物）を除く上記の成分を均一に溶解し、ついで本発明化合物を加えよく攪拌した後、サンドミルにて湿式粉碎してフロアブル剤を得る。使用に際しては、上記フロアブル剤を 50~20000 倍に希釈して有効成分量がヘクタール当たり 0. 005~50 kg になるように散布する。

〔製剤例 6〕 粒状水和剤

本発明化合物 No. II-1	75 部
ハイテノール NE-15	5 部

(アニオニン性界面活性剤：第一工業製薬（株）商品名)

パニレックスN 10部

(アニオン性界面活性剤：日本製紙（株）商品名)

カープレックス#80D 10部

(ホワイトカーボン：塩野義製薬（株）商品名)

以上を均一に混合微粉碎して少量の水を加えて攪拌混合し、押出式造粒機で造粒し、乾燥してドライフロアブル剤とする。使用に際しては水で50～20000倍に希釈して、有効成分が1ヘクタール当たり0.005～50kgになるよう散布する。

本発明化合物の施用方法としては、茎葉散布、土壤処理、種子消毒等が挙げられるが、通常当業者が利用する一般的な方法においても有効である。

本発明化合物の合成例を実施例として以下に示すが、本発明はこれらのみに限定されるものではない。

本発明化合物の合成例を実施例として以下に示すが、本発明はこれらのみに限定されるものではない。

〔実施例1〕

メチル 2-(2-(アザ(5-メチル-4-フェニル-2,5-チアゾリニデン)メチル)フェニル)酢酸(本発明化合物I-1)の合成

メチル 2-(2-(((メチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸 4.76g (20mmol) を23mlのN,N-ジメチルホルムアミドに溶解し、これにフェナシルプロマイド 3.98g (20mmol) を加えた。

115℃で3時間加熱攪拌した後、反応混合物に水50mlおよび1規定水酸化ナトリウム水溶液25mlを加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、ろ過し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム)にて精製することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(5-メチル-4-フェニル-2,5-チアゾリニニデン)メチル)フェニル)酢酸 6.6g を無色油状物として得た。

屈折率； $n_{D21.5}$ 1.5600

〔実施例2〕

メチル 2-(2-(アザ(5-メチル-4-フェニル-2,5-チアゾリニ

リデン) メチル) フェニル) - 3 - メトキシ - 2 - プロパン酸 (本発明化合物 I-37) および (本発明化合物 I-38) の合成

55 % 水素化ナトリウム 0.61 g (1.4 mmol) を 10 ml の N, N-ジメチルホルムアミドに懸濁し、これにメチル 2-(2-(アザ(5-メチル-4-フェニル)-2,5-チアゾリニリデン)メチル)フェニル)酢酸 2 g (6 mmol) およびギ酸メチル 3.6 g (6.0 mmol) を 40 ml の N, N-ジメチルホルムアミドに溶解したものを室温で加え、12時間攪拌した。この混合物に無水炭酸カリウム 8.28 g (6.0 mmol) を加え、次いでジメチル硫酸 1.51 g (1.2 mmol) を滴下した。室温にて、さらに3時間攪拌した後、反応混合物に水 150 ml を加え、酢酸エチルにて抽出した後、有機層を無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。ろ過後、溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) にて精製することにより、低極性成分として、E体のメチル 2-(2-(アザ(5-メチル-4-フェニル)-2,5-チアゾリニリデン)メチル)フェニル) - 3 - メトキシ - 2 - プロパン酸 0.84 g および高極性成分として、Z体のメチル 2-(2-(アザ(5-メチル-4-フェニル)-2,5-チアゾリニリデン)メチル)フェニル) - 3 - メトキシ - 2 - プロパン酸 0.24 g をそれぞれ無色結晶として得た。

E体 融点 ; 118 - 120 °C

Z体 融点 ; 141 - 143 °C

[実施例 3]

メチル 2-(2-(アザ(5-(ジメチルアミノ)-4-フェニル)(2,5-チアゾリニデン)メチル)フェニル)酢酸 (本発明化合物 III-11) の合成
 1,1-ジメチルヒドラジン 0.44 g (7.4 mmol) を 100 ml のテトラヒドロフランに溶解し、これにメチル 2-(2-イソチオシアネートフェニル)酢酸 1.53 g (7.4 mmol) を加えた。室温にて 1 時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジイソプロピルエーテルにて洗浄することによりメチル 2-(2-(((ジメチルアミノ)アミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸 1.43 g を無色結晶として得た。

融点；130—131℃

引き続き、得られたメチル 2-(2-(((ジメチルアミノ)アミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸 1.2 g (4.5 mmol) を N, N-ジメチルホルムアミド 5 ml に溶解し、これにフェナシルプロマイド 0.9 g (4.5 mmol) を加えた。室温にて 1 時間攪拌した後、反応混合物に水 20 ml および 1 規定水酸化ナトリウム水溶液 5 ml を加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、濾過し、減圧下溶媒を留去した、得られた残渣をジイソプロピルエーテルにて洗浄することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(5-(ジメチルアミノ)-4-フェニル(2,5-チアゾリニデン))メチル)フェニル)酢酸 1.1 g を無色結晶として得た。

融点；88—89℃

〔実施例 4〕

メチル 2-(2-(アザ(6-フェニル(2,6-チアザパーキドロイニデン))メチル)フェニル)酢酸 (本発明化合物 X-1) の合成

N-フェニル-N-アリルアミン 0.27 g (2 mmol) を 2 ml のテトラヒドロフランに溶解し、これにメチル 2-(2-イソチオシアネートフェニル)酢酸 0.41 g (2 mmol) を加えた。室温にて 16 時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジエチルエーテルにて洗浄することによりメチル 2-(2-(((フェニル-2-プロペニルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸 0.5 g を無色結晶として得た。

融点；72—73℃

引き続き得られた、メチル 2-(2-(((フェニル-2-プロペニルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸 0.4 g (1.2 mmol) をトリフルオロ酢酸 2 ml に溶解し、室温にて 16 時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去し、目的のメチル 2-(2-(アザ(6-フェニル(2,6-チアザパーキドロイニデン))メチル)フェニル)酢酸 0.33 g を淡黄色油状物として得た。

屈折率；n_{D21} 1.5728

〔実施例 5〕

メチル 2-(2-(アザ(5-メチル-3-メチレン(2、5-チアゾリニリデン)メチル)フェニル)酢酸(本発明化合物IX-1)の合成

N-メチル-N-プロパルギルアミン1.52g(22mmol)を200mLのテトラヒドロフランに溶解し、これにメチル 2-(2-イソチオシアネートフェニル)酢酸4.14g(20mmol)を加えた。室温にて2時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジイソプロピルエーテルにて洗浄し、メチル 2-(2-((メチル-2-プロピニルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸4.3gを無色結晶として得た。

融点；83-84℃

引き続き得られた、メチル 2-(2-((メチル-2-プロピニルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸を室温にて、2週間放置することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(5-メチル-3-メチレン(2、5-チアゾリニリデン)メチル)フェニル)酢酸を淡黄色油状物として得た。

屈折率； $n_{D21.0} 1.5078$

[実施例6]

メチル 2-(2-(アザ(5-メチル-3-(プロモメチル)-2、5-チアゾリニリデン)メチル)フェニル)酢酸 臭化水素酸塩(本発明化合物I-202)の合成

実施例5で得られた、メチル 2-(2-((メチル-2-プロピニルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸2.7g(10mmol)をクロロホルム50mLに溶解し、臭素1.6g(10mmol)を加えた。これを室温にて一時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去し、残渣を酢酸エチルにて洗浄することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(5-メチル-3-(プロモメチル)-2、5-チアゾリニリデン)メチル)フェニル)酢酸 臭化水素酸塩2.6gを無色結晶として得た。

融点；180-183℃

[実施例7]

メチル 2-(2-(アザ(5-メチル-3-(プロモメチル)-2、5-チアゾリジニリデン)メチル)フェニル)酢酸 臭化水素酸塩(本発明化合物IX-1)

3) の合成

N-メチル-N-アリルアミン 1. 56 g (2.2 mmol) を 200 ml のテトラヒドロフランに溶解し、これにメチル 2-(2-イソチオシアネートフェニル) 酢酸 4.14 g (2.0 mmol) を加えた。室温にて 2 時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジイソプロピルエーテルにて洗浄することによりメチル 2-(2-((メチル-2-プロペニルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸 3.9 g を無色結晶として得た。

融点；46-47°C

引き続き得られた、メチル 2-(2-((メチル-2-プロペニルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸 3.5 g (1.2.6 mmol) をクロロホルム 130 ml に溶解し、臭素 2 g (1.2.6 mmol) を加えた。これを室温にて 3 時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去し、残渣をジエチルエーテルにて洗浄することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(5-メチル-3-(ブロモメチル)-2、5-チアゾリジニリデン)メチル)フェニル)酢酸 臭化水素酸塩 5.4 g を無色結晶として得た。

融点；177-179°C

〔実施例 8〕

メチル 2-(2-(アザ(5-メチル-4-(トリフルオロメチル)(2、5-チアゾリニリデン)メチル)フェニル)酢酸(本発明化合物 I-29)の合成
 メチル 2-(2-((メチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸 1.5 g (6.3 mmol) および 3-ブロモ-1、1、1-トリフルオロ-2-ブロバノン 1.2 g (6.3 mmol) の N、N-ジメチルホルムアミド 5 ml 溶液を室温で 2 時間攪拌した。反応液に水および 1 規定水酸化ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルにて抽出した。この有機層を水および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、ろ過し、溶媒を減圧留去した。得られた残渣をジクロロメタン 30 ml に溶解し、ピリジン 3.13 g (39.6 mmol) を加え、そこにトリフルオロ酢酸無水物 1.67 g (8.0 mmol) を滴下し、室温で 1 時間攪拌した。析出した塩をろ過により取り除いた後、溶媒を減圧留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸

エチル=2:1)にて精製することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(5-メチル-4-(トリフルオロメチル)(2,5-チアゾリニリデン)メチル)フェニル)酢酸 1.8 g を無色油状物として得た。

屈折率; $n_{D21.5}$ 1.5528

[実施例9]

メチル 2-(2-(アザ(3-メチル-3-ヒドロベンゾチアゾール-2-イリデン)メチル)フェニル)酢酸(本発明化合物XI-1)の合成

トリメチルオキソニウムテトラフルオロボレート 0.45 g (3.03 mmol) を 15 ml の 1、2-ジクロロエタン中に懸濁させ、これに 2-クロロベンゾチアゾール 0.51 g (3.03 mmol) を加えた。この混合物を 60°C で 1.5 時間加熱攪拌した後、室温まで冷却し、さらに 2 ml の 1、2-ジクロロエタンに溶解したメチル 2-(2-アミノフェニル)酢酸 0.5 g (3.03 mmol) を加え、室温にて 2 時間攪拌した。反応混合物に 50 ml の飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、1、2-ジクロロエタンにて抽出した後、有機層を無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。ろ過後、溶媒を留去し、得られた残渣を分取高速液体クロマトグラフィー(アセトニトリル:水 = 4:1)、引き続き分取薄層クロマトグラフィー(クロロホルム)にて精製することによりメチル 2-(2-(アザ(3-メチル-3-ヒドロベンゾチアゾール-2-イリデン)メチル)フェニル)酢酸 0.52 g を無色油状物として得た。

屈折率; $n_{D21.5}$ 1.5512

[実施例10]

メチル 2-(2-(アザベンゾ[c]1,3-ジチオレン-2-イリデン)メチル)フェニル)酢酸(本発明化合物XI-3)の合成

トリメチルオキソニウムテトラフルオロボレート 0.45 g (3.03 mmol) を 15 ml の 1、2-ジクロロエタン中に懸濁させ、これに 1、3-ベンゾジチオール-2-チオン 0.56 g (3.03 mmol) を加えた。この混合物を 60°C で 30 分間加熱攪拌した後、室温まで冷却し、さらに 2 ml の 1、2-ジクロロエタンに溶解したメチル 2-(2-アミノフェニル)酢酸 0.5 g (3.03 mmol) を加え、室温にて 2.5 時間攪拌した。反応混合物に 50 ml

1 の飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、クロロホルムにて抽出した後、有機層を無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。ろ過後、溶媒を留去し、得られた残渣を分取高速液体クロマトグラフィー（アセトニトリル：水 = 4 : 1）にて精製することによりメチル 2-(2-(アザベンゾ[c]2,5-ジチオレン-2-イリデンメチル)フェニル)酢酸 0.1 g を淡黄色油状物として得た。

屈折率； $n_{D21.4} = 1.5032$

〔実施例 11〕

メチル 2-(2-(アザ(3-(4-プロモフェニル)(2,5-ジチオレニリデン))メチル)フェニル)酢酸（本発明化合物II-25）の合成

トリエチルアンモニウム 2-(2-メトキシ-2-オキソエチル)フェニルカルバモジチオエート 2.04 g (5.96 mmol) を 30 ml のクロロホルムに溶解し、これに 2 ml のクロロホルムに溶解させたトリエチルアミン 0.13 g (1.28 mmol) を加え、引き続き、2-プロモ-1-(4-プロモフェニル)エタノン 1.74 g (6.26 mmol) を加えた。室温で 4 時間攪拌した後、反応混合物を 1 規定塩酸にそぞぎ入れクロロホルムにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した後、ろ過し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ヘキサン = 1 : 2）にて精製することにより、メチル 2-(2-((2-オキソ-2-(4-プロモフェニル)エチルチオ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸を 1.53 g を得た。

引き続き、得られたメチル 2-(2-((2-オキソ-2-(4-プロモフェニル)エチルチオ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸を 1.53 g (3.49 mmol) を 15 ml の硫酸に溶解した。室温で 1 時間攪拌した後、反応混合物を氷水にそぞぎ入れ酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した後、ろ過し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル：ヘキサン = 1 : 3）にて精製し、ジイソプロピルエーテルにて洗浄することにより、目的のメチル 2-(2-(アザ(3-(4-プロモフェニル)(2,5-ジチオレニリデン))メチル)フェニル)酢酸 0.4 g を無色結晶として得た。

融点；109—112℃

〔実施例12〕

メチル 2-(2-((1、3-ジメチル-4-オキソ-2-イミダゾリジニリデン)アミノ)フェニル)酢酸(本発明化合物IX-8)の合成

サルコシンエチルエステル塩酸塩0.6g(4mmol)をクロロホルム15mLに懸濁させ、そこに室温でトリエチルアミン1.0g(10mmol)を滴下した。この懸濁混合溶液を氷冷し、メチル 2-(2-((メチルイミノ)メチレン)アミノ)フェニル)酢酸0.8g(4mmol)のクロロホルム(5mL)溶液を滴下した。反応液を室温に戻し、さらに3時間攪拌した。その後反応液を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、ろ過し、溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン：酢酸エチル=3:2)にて精製した後、ジイソプロピルエーテルにて結晶化することにより目的のメチル 2-(2-((1、3-ジメチル-4-オキソ-2-イミダゾリジニリデン)アミノ)フェニル)酢酸0.4gを無色結晶として得た。

融点；57—59℃

〔実施例13〕

メチル 2-(2-((6-メチル-3-フェニル(3H-2, 6-チアジニアリデン)アミノ)フェニル)酢酸(本発明化合物X-3)の合成

メチル 2-(2-イソチオシアネートフェニル)酢酸2.86g(13.8mmol)、およびN-(3-フェニル-2-プロペニリデン)メタンアミン2g(13.8mmol)をベンゼン30mLに溶解し、加熱還流下で2時間攪拌した。反応終了後、室温に戻し、溶媒を減圧留去した後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン：酢酸エチル=2:1)にて精製することにより目的のメチル 2-(2-((6-メチル-3-フェニル(3H-2, 6-チアジニアリデン)アミノ)フェニル)酢酸2.2gを無色油状物として得た。

屈折率；n_D21.51.6292

〔実施例14〕

メチル 2-(2-(アザ(3-フェニル(2, 5-オキサチオラニリデン)

) メチル) フェニル) 酢酸 (本発明化合物IX-14) の合成

メチル 2-(2-(1-アザ-2-(2-ヒドロキシ-2-フェニルエチルチオ)-2-メチルチオビニル) フェニル) 酢酸 0.3 g (0.8 mmol) をキシレン 10 ml に溶解し、加熱還流下で 1 時間攪拌した。反応終了後、室温に戻し、減圧下で溶媒を留去した後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) にて精製することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(3-フェニル(2,5-オキサチオラニリデン))メチル)フェニル) 酢酸 0.2 gを得た。

¹H NMR (CDCl₃, δ (ppm))

3.38 (dd, J=9.1, 11.0 Hz, 1H), 3.60-3.65 (m, 1H), 3.65 (s, 3H),
3.66 (s, 2H), 5.63 (dd, J=5.8, 9.1 Hz, 1H), 6.96-7.46 (m, 9H)

[実施例 15]

メチル 2-(2-(アザ(6-メチル-4-フェニル(3H-2、5、6-チアジアジニリデン))メチル)フェニル) 酢酸 (本発明化合物X-2) の合成

メチルヒドラジン 0.34 g (7.4 mmol) を 100 ml のテトラヒドロフランに溶解し、これにメチル 2-(2-イソチオシアネートフェニル) 酢酸 1.53 g (7.4 mmol) を加えた。室温にて 1 時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジイソプロピルエーテルにて洗浄することによりメチル 2-(2-(((アミノメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル) 酢酸 1.4 g を無色結晶として得た。

融点；149-150°C

引き続き得られた、メチル 2-(2-(((アミノメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル) 酢酸 1.1 g (4.3 mmol) を N, N-ジメチルホルムアミド 5 ml に溶解し、これにフェナシルプロマイド 0.87 g (4.3 mmol) を加えた。室温にて 2 時間攪拌した後、反応混合物に水 20 ml および 1 規定水酸化ナトリウム水溶液 5 ml を加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、濾過し、減圧下溶媒を留去した、得られた残渣をジイソプロピルエーテルにて洗浄することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(6-メチル-4-フェニル(3H-2、5、6-チアジアジニリデ

ン) メチル) フェニル) 酢酸 1. 4 g を無色結晶として得た。

融点； 85 – 86 °C

〔実施例 16〕

メチル 2 – (2 – (アザ(5 – メチル – 3 – フェニル(2、4、5 – チアジアゾリニリデン)) メチル) フェニル) 酢酸(本発明化合物IX-10) の合成

実施例 15 により得られた、メチル 2 – ((アミノメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ) フェニル) 酢酸 8 g (31. 6 mmol) をピリジン 20 ml に溶解し、混合物を 0 °C まで冷却した後、ベンゾイルクロライド 4. 44 g (31. 6 mmol) を加えた。反応混合物を室温まで昇温し、さらに室温にて 2 時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣に水 50 ml および 1 規定塩酸を加え pH = 3 とした後、酢酸エチルで抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、濾過し、減圧下溶媒を留去した、得られた残渣をジイソプロピルエーテルにて洗浄することによりメチル 2 – ((メチル(フェニルカルボニルアミノ) アミノ) チオキソメチル) アミノ) フェニル) 酢酸 8. 1 g を無色結晶として得た。

融点； 148 – 150 °C

引き続き得られた、メチル 2 – ((メチル(フェニルカルボニルアミノ) アミノ) チオキソメチル) アミノ) フェニル) 酢酸 5. 36 g (15. 4 mmol) を濃硫酸 25 ml に少量ずつ加えた。室温にて 2 時間攪拌後、冰水 20 ml に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、濾過し、減圧下溶媒を留去した、得られた残渣をジイソプロピルエーテルにて洗浄することにより目的のメチル 2 – (アザ(5 – メチル – 3 – フェニル(2、4、5 – チアジアゾリニリデン)) メチル) フェニル) 酢酸 3 g を無色結晶として得た。

融点； 76 – 77 °C

〔実施例 17〕

メチル 2 – (2 – (アザ(5 – メチル – 3 – フェニル(2、4、5 – オキシアゾリニリデン)) メチル) フェニル) 酢酸(本発明化合物IX-9) の合成

実施例 16 により得られた、メチル 2 – ((メチル(フェニルカル

ボニルアミノ) アミノ) チオキソメチル) アミノ) フェニル) 酢酸 3. 8 g (1 0. 6 mmol) をアセトンに溶解した。次いで、1 規定炭酸カリウム水溶液 3 5 ml およびヨウ化エチル 2 ml を加え、60 °C にて 2 時間攪拌後、減圧下溶媒を留去した。残渣に水 20 ml を加え析出した結晶を濾取した。得られた結晶を酢酸エチルに溶解し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後濾過し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジイソプロピルエーテルにて洗浄することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(5-メチル-3-フェニル(2, 4, 5-オキサジアゾリニリデン)メチル)フェニル)酢酸 2. 4 g を無色結晶として得た。

融点；97-99 °C

〔実施例 18〕

メチル 2-(2-(1-アザ-2-(ジメチルアミノ)-2-(2-(2-クロロフェニル)-2-オキソエチルチオ)ビニル)フェニル)酢酸（化合物 XI I-14）の合成

メチル 2-(2-(((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸 0. 4 g (1. 59 mmol) を 12 ml の 1, 4-ジオキサンに溶解し、これに 2-クロロフェナシルプロマイド 0. 37 g (1. 59 mmol) を加えた。室温で 6 時間攪拌した後、析出した結晶をろ取し、ジエチルエーテルで洗浄を行った。得られた結晶を 1 規定水酸化ナトリウム水溶液 10 ml に溶解し、酢酸エチルにて抽出を行った。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去することにより、メチル 2-(2-(1-アザ-2-(ジメチルアミノ)-2-(2-クロロフェニル)-2-オキソエチルチオ)ビニル)フェニル)酢酸 0. 38 g を無色油状物として得た。

屈折率；n_{D21}. 31.5364

〔実施例 19〕

メチル 2-(2-(アザ(3-(2-メトキシフェニル)(2, 5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸（本発明化合物 II-5）の合成

メチル 2-(2-(((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸 1 g (3. 96 mmol) を 20 ml の 1, 4-ジオキサンに溶解し、これに 2-メトキシフェナシルプロマイド 0. 91 g (3. 96 mmol) を加

えた。20時間加熱還流を行った後、減圧下1,4ジオキサンを留去した。得られた反応混合物を1規定水酸化ナトリウム水溶液10mlに溶解し、酢酸エチルにて抽出を行った後、有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（酢酸エチル：ヘキサン=1:4）にて精製することにより目的のメチル2-(2-(アザ(3-(2-メトキシフェニル)(2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸0.9gを無色油状物として得た。

屈折率； $n_{D21.7} 1.5262$

〔実施例20〕

メチル2-(2-(アザ(3-(2-メチルプロピル)(2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸（本発明化合物II-20）の合成

メチル2-(2-イソチオシアネートフェニル)酢酸1.04g(5mmol)およびイミダゾール3g(4.4mmol)をジオキサン30mlに溶解し、1-ブロモ-4-メチル-2-ペントノン1.8g(1.0mmol)を加えて、室温で30分攪拌した。この反応液にさらに0.9g(5mmol)の、1-ブロモ-4-メチル-2-ペントノンを加え、30分攪拌する操作を2回行った。その後、反応液を加熱還流下で3時間攪拌した後、室温に戻し、溶媒を減圧留去した。得られた残渣に1規定水酸化ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルにて抽出し、有機層を飽和食塩水にて洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、ろ過後、溶媒を減圧留去した。得られた残渣を2回のシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン:酢酸エチル=4:1、クロロホルム)にて精製することにより目的のメチル2-(2-(アザ(3-(2-メチルプロピル)(2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸0.3gを無色油状物として得た。

屈折率； $n_{D21.5} 1.5630$

〔実施例21〕

メチル2-(2-(アザ(2-メチル-3,5-ジメトキシ-2,6-ピリミジニリデン)メチル)フェニル)酢酸（本発明化合物X-4）の合成

トリメチルオキソニウムテトラフルオロボレート0.45g(3.03mmol)

1) を 1.5 ml の 1, 2-ジクロロエタン中に懸濁させ、これに 2-クロロ-4, 6-ジメトキシピリミジン 0.53 g (3.03 mmol) を加えた。この混合物を 60 °C で 1 時間加熱攪拌した後、室温まで冷却し、さらに 2 ml の 1, 2-ジクロロエタンに溶解したメチル 2-(2-アミノフェニル) 酢酸 0.5 g (3.03 mmol) を加え、室温にて 2.5 時間攪拌した。反応混合物に 50 ml の飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、クロロホルムにて抽出した後、有機層を無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。ろ過後、溶媒を留去し、得られた残渣を分取高速液体クロマトグラフィー (アセトニトリル : 水 = 4 : 1) にて精製することにより、メチル 2-(2-(アザ(2-メチル-3,5-ジメトキシ-2,6-ピリミジニリデン)メチル)フェニル) 酢酸 60 mg を無色結晶として得た。

融点 ; 122-123°C

〔実施例 2-2〕

メチル 2-(2-(アザ(2-メチル-3-フルオロ-2-ピリジニリデン)メチル)フェニル) 酢酸 (本発明化合物 X-5) の合成

トリメチルオキソニウムテトラフルオロボレート 0.45 g (3.03 mmol) を 1.5 ml の 1, 2-ジクロロエタン中に懸濁させ、これに 2, 6-ジフルオロピリジン 0.35 g (3.03 mmol) を加えた。この混合物を 60 °C で 2 時間加熱攪拌した後、室温まで冷却し、さらに 2 ml の 1, 2-ジクロロエタンに溶解したメチル 2-(2-アミノフェニル) 酢酸 0.5 g (3.03 mmol) を加え、室温にて 6 日間攪拌した。反応混合物に 50 ml の飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、クロロホルムにて抽出した後、有機層を無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。ろ過後、溶媒を留去し、得られた残渣を分取高速液体クロマトグラフィー (アセトニトリル : 水 = 4 : 1) にて精製することにより、メチル 2-(2-(アザ(2-メチル-3-フルオロ-2-ピリジニリデン)メチル)フェニル) 酢酸 80 mg を橙色油状物として得た。

屈折率 ; $n_{D21.7} 1.5286$

〔実施例 2-3〕

メチル 2-(2-(アザ(6-メチル-5-フェニル(2H-3,6-チア

WO 03/000659

ジニリデン)) メチル) フェニル) 酢酸 (本発明化合物X-9) の合成
 チオグリコール酸アミド 10 g (0. 11 mol) およびトリエチルアミン 1
 1. 2 g (0. 11 mol) をメチルエチルケトン (100 ml) に懸濁させ、
 氷冷下フェナシルプロマイド 22 g (0. 11 mol) を加え、反応液を 7 時間
 加熱還流させた。室温まで放冷した後溶媒を減圧留去し、水を加えた。酢酸エチ
 ルにて抽出し、有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥
 後、ろ過し、溶媒を減圧留去した。ジイソプロピルエーテルおよびジエチルエー
 テルの混合溶液から結晶化させ、減圧ろ過、乾燥することによりフェナシルチオ
 酢酸アミド 20. 6 g (0. 1 mol) を得た。

融点；106-107°C

得られた、フェナシルチオ酢酸アミド 20. 4 g (0. 1 mol) のトルエン
 80 ml の懸濁溶液に触媒量の p-トルエンスルホン酸を加え、脱水しながら 6
 0 時間加熱還流した。室温まで放冷した後、析出した結晶をトルエンおよびジエ
 チルエーテルにて洗浄し、減圧乾燥することにより 5-フェニル-2H-1, 4
 -チアジン-3 (4H)-オン 17. 4 g (9. 1 mmol) を得た。

融点；150-155°C

引き続き得られた、5-フェニル-2H-1, 4-チアジン-3 (4H)-オン 13 g (6. 8 mmol) を 300 ml のアセトニトリルに溶解し、炭酸カリウ
 ム 14. 1 g (13. 8 mmol) およびヨウ化メチル 38. 7 g (27. 3 mmol)
 を加え、30 時間加熱還流した。反応混合物を冷却し、生成した沈殿を濾去
 し、濾液を濃縮乾固した。得られた残さをクロロホルムと水とに分配し、有機層
 を濃縮して得られるシラップをジイソプロピルエーテルから結晶化した。濾取し
 た後、減圧乾燥することにより、4-メチル-5-フェニル-2H-1, 4-
 チアジン-3 (4H)-オン 8 g (3. 9 mmol) を得た。

融点；95-97°C

引き続き得られた、4-メチル-5-フェニル-2H-1, 4-チアジン-3
 (4H)-オン 2. 7 g (1. 3. 2 mmol) を 50 ml の 1, 4-ジオキサン
 に溶解させ、そこにローソン試薬 (Lawesson's Reagent) 3
 . 9 g (9. 6 mmol) を加え、70°Cで 5 時間攪拌した。室温まで放冷し、

不溶物を濾去し、溶媒を減圧留去した。得られた残さを少量のエタノールから結晶化した。濾取した後、減圧乾燥させることにより 4-メチル-5-フェニル-2H-1、4-チアジン-3(4H)-チオン 2.3 g (10.4 mmol) を得た。

融点；83-85°C

引き続き得られた、4-メチル-5-フェニル-2H-1、4-チアジン-3(4H)-チオン 2 g (9 mmol) をアセトン (20 ml) に溶解し、ヨウ化メチル 4 g (28 mmol) を加えて 9 時間加熱還流した。室温まで放冷し析出している沈殿物を濾取し、ジイソプロピルエーテルで洗浄し、減圧乾燥することにより 4-メチル-3-メチルチオ-5-フェニル-2H-1、4-チアジニウム ヨージド 2.4 g (6.6 mmol) を得た。

融点；140-145°C (分解)

引き続きメチル 2-(2-アミノフェニル) 酢酸 0.34 g (2.1 mmol) を 10 ml の 1、2-ジクロロエタンに溶解させ、得られた 4-メチル-3-メチルチオ-5-フェニル-2H-1、4-チアジニウム ヨージド 0.5 g (1.4 mmol) を加えて、室温で 3 時間攪拌した。反応終了後、1 規定の水酸化ナトリウム水溶液を加え、クロロホルムにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、ろ過し、溶媒を減圧留去した。シリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル = 2 : 1) にて精製することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(6-メチル-5-フェニル(2H-3, 6-チアジニリデン))メチル)フェニル) 酢酸 0.36 g (1 mmol) を得た。

屈折率； $n_{D20.4}$ 1.6251

〔実施例 24〕

メチル 2-(2-(アザ(4-(アザフェニルメチレン)-5-メチル(2,5-チアゾリジニリデン))メチル)フェニル) 酢酸 (本発明化合物 IX-16) の合成

アニリン 1.40 g (15.0 mmol) を 40 ml のテトラヒドロフランに溶解し、これにプロモアセチルクロライド 2.50 g (15.9 mmol) を 1

m 1 のテトラヒドロフランに溶解したものおよびトリエチルアミン 1. 72 g (17. 0 mmol) を 2 m 1 のテトラヒドロフランに溶解したものを室温で加え、4 時間攪拌した。反応混合物を 1 規定の塩酸にそそぎ、酢酸エチルにて抽出した。有機層を 1 規定の水酸化ナトリウム水溶液、次いで飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した後、ろ過し、減圧下溶媒を留去し、2-ブロモ-N-フェニルアセトアミド 3. 01 gを得た。

得られた、2-ブロモ-N-フェニルアセトアミド 1. 59 g (7. 43 mmol) を 30 m 1 のテトラヒドロフランに溶解し、これにメチル 2-(2-(2-(メチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸 1. 61 g (6. 76 mmol) を室温で加え 4 時間 30 分攪拌した。反応中に析出した塩をろ取することにより、メチル 2-(2-(1-アザ-2-(メチルアミノ)-2-(2-アニリノ-2-オキソエチルチオ)ビニル)フェニル)酢酸 臭化水素酸塩 2. 62 gを得た。

引き続き得られたメチル 2-(2-(1-アザ-2-(メチルアミノ)-2-(2-アニリノ-2-オキソエチルチオ)ビニル)フェニル)酢酸 臭化水素酸塩 2. 62 g (5. 79 mmol) を 30 m 1 の 1, 2-ジクロロエタンに溶解し、これにトリエチルアミン 0. 66 g (6. 52 mmol) を 1 m 1 の 1, 2-ジクロロエタンに溶解したもの、四塩化炭素 2. 00 g (13 mmol) を 1 m 1 の 1, 2-ジクロロエタンに溶解したものおよびトリフェニルホスフィン 3. 66 g (12. 8 mmol) を室温にて加え、24 時間攪拌した。この反応混合物に水を加えクロロホルムにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した後、ろ過し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) にて精製することにより、目的のメチル 2-(2-(アザ(4-(アザフェニルメチレン)-5-メチル(2, 5-チアゾリジンニリデン))メチル)フェニル)酢酸 0. 10 gを得た。

屈折率 ; nD₂₀. 71. 5326

〔実施例 25〕

メチル 2-(2-(アザ(3-(4-t-ブチルフェニル)-4-クロロ-

2, 5-オキサチオレニリデン) メチル) フェニル) 酢酸 (本発明化合物II-425)
の合成

メチル 2-(2-(((ジメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ) フェニル) 酢酸 0. 64 g (2. 55 mmol) を 20 ml の N, N-ジメチルホルムアミドに溶解し、これに 2-ブロモ-1-(4-t-ブチルフェニル)-1-エタノン 0. 65 g (2. 55 mmol) を加えた。120°Cにて2時間攪拌を行った後、水 50 ml を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフィー (アセトニトリル:水 = 4 : 1) にて精製することによりメチル 2-(2-(アザ(3-(4-t-ブチルフェニル)(2, 5-オキサチオレニリデン) メチル) フェニル) 酢酸 0. 22 g を無色油状物として得た。

得られたメチル 2-(2-(アザ(3-(4-t-ブチルフェニル)(2, 5-オキサチオレニリデン) メチル) フェニル) 酢酸 0. 21 g (0. 55 mmol) を 20 ml の 1, 2-ジクロロエタンに溶解し、これに N-クロロホウ酸イミド 0. 07 g (0. 55 mmol) および触媒量のアゾビスイソブチロニトリルを加えた。還流下 20 時間攪拌を行った後、得られた反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム) にて精製することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(3-(4-t-ブチルフェニル)-4-クロロ-(2, 5-オキサチオレニリデン) メチル) フェニル) 酢酸 0. 20 g を無色油状物として得た。

屈折率 ; $n_{D20.7}$ 1.5306

〔実施例 26〕

メチル 2-(2-(アザ(3-(4-クロロフェニル)-4-メチルメルカプト-2, 5-オキサチオレニリデン) メチル) フェニル) 酢酸 (本発明化合物 II-404) の合成

メチル 2-(2-(((ジメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ) フェニル) 酢酸 0. 99 g (3. 93 mmol) を 10 ml の N, N-ジメチルホルム

アミドに溶解し、これに2-ブロモ-1-(4-クロロフェニル)-2-メチルメルカプト-1-エタノン1.1g(3.93mmol)を加えた。120℃にて2時間攪拌を行った後、水50mlを加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフィー(アセトニトリル:水=4:1)にて精製することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(3-(4-クロロフェニル)-4-メチルメルカプト-(2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸1.05gを無色油状物として得た。

屈折率; $n_{D21.3}$ 1.5336

[実施例27]

メチル 2-(2-(アザ(3-(3,4,5-トリフルオロフェニル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸(本発明化合物II-307)の合成

メチル 2-(2-(((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸0.68g(3mmol)を20mlの1,4-ジオキサンに溶解し、これに2-ブロモ-1-(3,4,5-トリフルオロフェニル)-1-ブロバン1.1g(3.93mmol)を加えた。120℃にて2.5時間攪拌を行った後、減圧下溶媒を留去し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液50mlを加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフィー(アセトニトリル:水=4:1)にて精製することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(3-(3,4,5-トリフルオロフェニル)-4-メチル-(2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸0.57gを無色油状物として得た。

屈折率; $n_{D21.9}$ 1.5418

[実施例28]

メチル 2-(2-(アザ(3-(2-フルオロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)-4-メトキ

シフェニル) 酢酸 (本発明化合物II-244) の合成

メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-4-メトキシフェニル)酢酸 0.282 g (1 mmol) を 2 ml の N, N-ジメチルホルムアミドに溶解し、これに 2-ブロモ-1-(2-フルオロー-4-トリフルオロメチルフェニル)-1-プロパン 0.3 g (1 mmol) を加えた。80°C にて 5 時間攪拌を行った後、水 10 ml を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) にて精製することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(3-(2-フルオロー-4-トリフルオロメチルフェニル)-4-メチル-(2,5-オキサチオレニリデン)メチル)-4-メトキシフェニル)酢酸 0.21 g を無色油状物として得た。

屈折率 ; $n_{D^{20.2}}$ 1.3871

[実施例 29]

メチル 2-(2-(アザ(3-(2-フルオロー-4-トリフルオロメチルフェニル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)-6-メチルフェニル)酢酸 (本発明化合物II-297) の合成

メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-6-メチルフェニル)酢酸 0.266 g (1 mmol) を 2 ml の N, N-ジメチルホルムアミドに溶解し、これに 2-ブロモ-1-(2-フルオロー-4-トリフルオロメチルフェニル)-1-プロパン 0.3 g (1 mmol) を加えた。80°C にて 5 時間攪拌を行った後、水 10 ml を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジイソプロピルエーテルにて洗浄することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(3-(2-フルオロー-4-トリフルオロメチルフェニル)-4-メチル-(2,5-オキサチオレニリデン)メチル)-6-メチルフェニル)酢酸 0.1 g を無色結晶として得た。

融点 : 88-89°C

[実施例 30]

メチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸(本発明化合物VII-1)の合成

メチル 2-(2-(((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸 0.894 g (3.55 mmol) を 7 ml の 1,4-ジオキサンに溶解し、これに 2-プロモ-1-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-1-プロパノン 1 g (3.55 mmol) を 加えた。2 時間加熱還流を行った後、減圧下 1,4-ジオキサンを留去した。得られた反応混合物を薄層シリカゲルクロマトグラフィー(酢酸エチル:ヘキサン = 1:4)にて精製することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸 0.9 g を無色結晶として得た。

融点: 64-67°C

〔実施例 3 1〕

メチル 2-(2-(アザ(3-(6-トリフルオロメチルピリジン-3-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸(本発明化合物VIII-1)の合成

メチル 2-(2-(((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸 1.2 g (4.76 mmol) を 5 ml の 1,4-ジオキサンに溶解し、これに 2-プロモ-1-(6-トリフルオロメチルピリジン-3-イル)-1-プロパノン 1.39 g (4.93 mmol) を 加えた。1 時間加熱還流を行った後、減圧下 1,4-ジオキサンを留去した。得られた反応混合物を薄層シリカゲルクロマトグラフィー(酢酸エチル:ヘキサン = 3:7)にて精製することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(3-(6-トリフルオロメチルピリジン-3-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸 1.2 g を無色油状物として得た。

屈折率; $n_{D24.2} 1.4715$

〔実施例 3 2〕

メチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)

ル) 2, 5-オキサチオレニリデン) メチル) フェニル) 酢酸 (本発明化合物VI I-2) の合成

メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸 1.41g (5.6mmol) を 15ml の N, N-ジメチルホルムアミドに溶解し、これに 2-ブロモ-1-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-1-エタノン 1.5g (5.6mmol) を加えた。100℃にて4時間攪拌を行った後、水 50ml を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム) にて精製することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸 1.22g を無色結晶として得た。

融点 : 97-99℃

〔実施例 33〕

メチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-4-クロロ-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸 (本発明化合物VII-11) の合成

実施例 32 で得られた、メチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸 1.22g (3.09mmol) を 20ml の 1,2-ジクロロエタンに溶解し、これに N-クロロコハク酸イミド 0.45g (3.4mmol) および触媒量のアゾビスイソブチロニトリルを加えた。還流下 80 時間攪拌を行った後、得られた反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフィー (アセトニトリル:水 = 4:1) にて精製することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-4-クロロ-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸 0.16g を無色油状物として得た。

¹H NMR (CDCl₃, δ (ppm)) : 3.64(s, 3H), 3.68(s, 2H), 7.02-8.04(m, 6H), 8.83(s, 1H)

[実施例 3 4]

メチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸(本発明化合物IV-9)の合成

メチル 2-(2-(((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸 5.8 g (22.83 mmol) を 100 ml の N, N-ジメチルホルムアミドに溶解し、これに 2-ブロモ-1-(5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-イル)-1-プロパン 10 g (5.6 mmol) を加えた。100°Cにて4時間攪拌を行った後、水 50 ml を加え、析出した結晶をろ取することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸 4.8 g を無色結晶として得た。

融点：95-96°C

[実施例 3 5]

メチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-シアノメチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸(本発明化合物IV-16)およびメチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-シアノメチルピラゾール-5-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸(本発明化合物V-10)の合成

実施例 3 4 にて得られた、メチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸 0.41 g (1.03 mmol) をアセトニトリルに溶解し、次いで、クロロアセトニトリル 0.15 g (2.06 mmol) および炭酸カリウム 0.3 g (2.17 mmol) を加え、80°Cにて8時間攪拌した。反応混合物を減圧下溶媒を留去し、水 50 ml を加え、酢酸エチルにて抽出した。無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去し得られた残渣

をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（n-ヘキサン：酢酸エチル=3:1）にて精製することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-シアノメチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸0.17gおよびメチル 2-(2-(アザ(3-(3-トリフルオロメチル-1-シアノメチルピラゾール-5-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸0.25gをそれぞれ無色油状物として得た。

メチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-シアノメチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸

屈折率； $n_{D22.1}$ 1.4558

メチル 2-(2-(アザ(3-(3-トリフルオロメチル-1-シアノメチルピラゾール-5-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸

屈折率； $n_{D22.3}$ 1.4950

〔実施例36〕

メチル 2-(2-(アザ(3-(3-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-5-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸（本発明化合物V-1）の合成

メチル 2-(2-(((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸0.668g(2.65mmol)を10mlのN,N-ジメチルホルムアミドに溶解し、これに2-ブロモ-1-(3-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-1-プロパン0.84g(2.95mmol)を加えた。100°Cにて30分間攪拌を行った後、減圧下溶媒を留去した。得られた反応混合物を薄層シリカゲルクロマトグラフィー（酢酸エチル：ヘキサン=2:3）にて精製することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(3-(3-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-5-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸0.5gを無色油状物として得た。

屈折率 ; n_{D21} . 01. 4868

〔実施例 37〕

メチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン)メチル)-6-メチルフェニル)酢酸(本発明化合物IV-3)の合成

メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-6-メチルフェニル)酢酸 0. 4 g (1. 5 mmol) を 3 ml の N, N-ジメチルホルムアミドに溶解し、これに 2-プロモ-1-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-1-プロパン 0. 71 g (1. 5 mmol) を加えた。100°Cにて30分間攪拌を行った後、減圧下溶媒を留去した。得られた反応混合物を薄層シリカゲルクロマトグラフィー(酢酸エチル:ヘキサン = 3 : 7)にて精製することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン)メチル)-6-メチルフェニル)酢酸 0. 4 g を無色油状物として得た。

屈折率 ; n_{D21} . 71. 5206

〔実施例 38〕

メチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン)メチル)-6-メチルフェニル)酢酸(本発明化合物VII-6)の合成

メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-6-メチルフェニル)酢酸 0. 532 g (2 mmol) を 2 ml の N, N-ジメチルホルムアミドに溶解し、これに 2-プロモ-1-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-1-プロパン 0. 564 g (2 mmol) を加えた。100°Cにて2時間攪拌を行った後、反応混合物に水 10 ml を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフィー(酢酸エチル:ヘキサン = 1 : 1)にて精製することにより目的のメチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)

) - 4 - メチル - 2 , 5 - オキサチオレニリデン) メチル) - 6 - メチルフェニル) 酢酸 0.57 g を無色結晶として得た。

融点 : 116 - 117 °C

〔実施例 39〕

メチル 2 - (2 - (アザ (3 - (5 - トリフルオロメチル - 1 , 2 , 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) - 4 - メチル - 2 , 5 - オキサチオレニリデン) メチル) フェニル) 酢酸 (本発明化合物II-339) の合成

参考例 20 により得られた 2 - (2 - メトキシカルボニルメチル - フェニルイミノ) - [1 , 3] オキサチオール - 4 - メチル - 5 - カルボン酸 4.25 g (13.8 mmol) をベンゼン 70 ml に溶解し、塩化チオニル 5.02 g (4.22 mmol) を加え、還流下 2.5 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣にテトラヒドロフラン 70 ml を加え、冰冷下 28% アンモニア水 4.31 g (70.9 mmol) を加え、室温にて 10 分間攪拌した後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣に水 100 ml を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより、2 - (2 - メトキシカルボニルメチル - フェニルイミノ) - [1 , 3] オキサチオール - 4 - メチル - 5 - カルボン酸アミド 2.92 g を無色結晶として得た。

融点 : 128 - 132 °C

引き続き 2 - (2 - メトキシカルボニルメチル - フェニルイミノ) - [1 , 3] オキサチオール - 4 - メチル - 5 - カルボン酸アミド 2.01 g (6.56 mmol) をテトラヒドロフラン 40 ml に溶解し、次いで、ピリジン 2.61 g (33 mmol) およびトリフルオロ酢酸無水物 1.53 g (7.28 mmol) を加え室温にて 2.75 時間攪拌した。反応混合物に、酢酸エチルおよび水を加えた後、1 規定塩酸にて pH 2 に調整した。酢酸エチルにて抽出し水および飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム) にて精製することにより、2 - (2 - メトキシカルボニルメチル - フェニルイミノ) - [1 , 3] オキサチオール - 4 - メチル - 5 - ニトリル 1.31 g を得た。

ヒドロキシルアミン塩酸塩 0. 23 g (3. 31 mmol) をメタノール 15 ml に溶解し、ナトリウムメトキシド 0. 19 g (3. 52 mmol) および 2 - (2-メトキシカルボニルメチルフェニルイミノ) - [1, 3] オキサチオール - 4-メチル - 5-ニトリル 0. 95 g (3. 29 mmol) を加え室温にて、1. 5 時間攪拌した。さらにヒドロキシルアミン塩酸塩 0. 044 g (0. 633 mmol) およびナトリウムメトキシド 0. 036 g (0. 666 mmol) を加え、引き続き 2. 5 時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をテトラヒドロフラン 25 ml に溶解し、トリフルオロ酢酸無水物 3. 44 g (16. 38 mmol) を加え、22. 5 時間室温にて攪拌後、50℃にて 30 分間攪拌した。次いで、還流下 8 時間攪拌後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣に、水を加え、酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄した。無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン : 酢酸エチル = 5 : 1) にて精製することにより、目的のメチル 2 - (2 - (アザ (3 - (5 - トリフルオロメチル - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - イル) - 4 - メチル - 2, 5 - オキサチオレニリデン) メチル) フェニル) 酢酸 0. 15 g を無色油状物として得た。

屈折率 ; $n_{D21.5} = 1.5318$

〔実施例 40〕

メチル 2 - (2 - (アザ (3 - (3 - フェニル - 1, 2, 4 - オキサジアゾール - 5 - イル) - 4 - メチル - 2, 5 - オキサチオレニリデン) メチル) フェニル) 酢酸 (本発明化合物 II-405) の合成

参考例 20 により得られた 2 - (2 - メトキシカルボニルメチルフェニルイミノ) - [1, 3] オキサチオール - 4 - メチル - 5 - カルボン酸 1. 43 g (4. 65 mmol) をベンゼン 20 ml に溶解し、塩化チオニル 1. 7 g (14. 3 mmol) を加え、還流下 1. 5 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をクロロホルム 10 ml に溶解し、冰冷下、ベンズアミジン 1. 1 g (7. 02 mmol), トリエチルアミン 1. 42 g (14 mmol) およびクロロホルム 20 ml の混合物に加えた。室温にて

24時間攪拌後、減圧下溶媒を留去し、水を加えた後、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水にて洗浄した後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル）にて精製することにより、
 2-(2-メトキシカルボニルメチルフェニルイミノ)-[1,3]オキサチオール-4-メチル-5-カルボン酸フェニルアミジド1.4gを得た。得られた2-(2-メトキシカルボニルメチルフェニルイミノ)-[1,3]オキサチオール-4-メチル-5-カルボン酸フェニルアミジド1.4gをメタノール30mlおよび水20mlに溶解し、次亜塩素酸ナトリウム水溶液（有功塩素濃度8%）4.24g（4.56mmol）および炭酸ナトリウム0.55g（5.19mmol）を加え室温にて、4時間攪拌した。反応混合物に水を加え、酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去し、得られた残渣を薄層シリカゲルカラムクロマトグラフィー（n-ヘキサン：酢酸エチル=3:2）にて精製することにより、目的のメチル2-(2-(アザ(3-(3-フェニル-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸0.18gを得た。

融点：140-143°C

〔実施例41〕

メチル2-(2-(アザ(3-(5-メチル-1,3,4-チアジアゾール-2-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸（本発明化合物II-336）の合成

参考例20により得られた2-(2-メトキシカルボニルメチルフェニルイミノ)-[1,3]オキサチオール-4-メチル-5-カルボン酸4g（13mmol）をベンゼン200mlに溶解し、塩化チオニル3.88g（32.5mmol）を加え、還流下1.5時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣の半量を、アセトヒドラジド0.625g（8.45mmol）、トリエチルアミン1.313g（13mmol）および1,2-ジクロロエタン30mlの混合物に加え、室温にて2時間攪拌した。減圧

下溶媒を留去し、水を加えた後、酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をトルエン 20 ml に溶解し、次いで、ローソン試薬 (Lawesson's Reagent) 1.5 g を加え、還流下 1.5 時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル) および薄層シリカゲルクロマトグラフィー (n-ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) にて精製することにより、目的のメチル 2-(2-(アザ(3-(5-メチル-1,3,4-チアジアゾール-2-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸 0.7 g を無色油状物として得た。

屈折率 ; $n_{D21} = 1.6528$

〔実施例 4-2〕

メチル 2-(2-(アザ(3-(2-トリフルオロメチルチアゾール-5-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸 (本発明化合物II-423) の合成

参考例 20 により得られた 2-(2-メトキシカルボニルメチル-フェニルイミノ)-[1,3]オキサチオール-4-メチル-5-カルボン酸 7 g (22.8 mmol) をベンゼン 300 ml に溶解し、塩化チオニル 6.78 g (57 mmol) および N, N-ジメチルホルムアミド 1 滴を加え、還流下 2 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を、アセトニトリル 100 ml、塩化マグネシウム 2.166 g (22.8 mmol) およびトリエチルアミン 4.605 g (45.6 mmol) の混合物に加え、室温にて 48 時間攪拌した。反応混合物を氷水に注ぎ、濃塩酸にて pH を 2 に調整した後、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジメチルスルホキシド 100 ml に溶解し、水 0.718 g (39.9 mmol) を加え、140°C にて 5 時間攪拌した。反応混合物に水 100 ml を加え、酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水にて精製後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン :

酢酸エチル=5:2)にて精製することにより2-(2-メトキシカルボニルメチルフェニルイミノ)-4-メチル-5-アセチル-[1,3]オキサチオール4gを得た。

屈折率: n_{D21} 1.5436

次いで、得られた2-(2-メトキシカルボニルメチルフェニルイミノ)-4-メチル-5-アセチル-[1,3]オキサチオール0.74g(2.43mmol)を4塩化炭素15mlに溶解し、トリメチルシリルクロリド0.53g(4.86mmol)を加え、室温にて5分攪拌した後、臭素0.582g(3.64mmol)を加えた。さらに室温にて15時間攪拌後、減圧下溶媒を留去し、水50mlを加え酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をN,N-ジメチルホルムアミド15mlに溶解し、ついで、トリフルオロアセトチオアミド0.234g(1.82mmol)を加え、室温にて2時間攪拌した後、110°Cにて3時間攪拌した。反応混合物に水を加え、酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフィー(*n*-ヘキサン:酢酸エチル=3:1)にて精製することにより目的のメチル2-(2-(アザ(3-(2-トリフルオロメチルチアゾール-4-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸35mgを無色結晶として得た。

融点: 125-126°C

〔実施例43〕

メチル2-(2-(アザ(3-(4-トリフルオロメチル-4-ヒドロキシ-チアゾリン-2-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸(本発明化合物II-427)の合成

実施例39にて得られた2-(2-メトキシカルボニルメチルフェニルイミノ)-[1,3]オキサチオール-4-メチル-5-カルボン酸アミド3.9g(12.7mmol)をトルエン60mlに溶解し、ついでローソン試薬(La

wesson's Reagent) 5. 137 g (12. 7 mmol) を加え、還流下 1. 5 時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル = 2 : 1) にて精製することにより 2-(2-メトキシカルボニルメチルフェニルイミノ)-[1, 3]オキサチオール-4-メチル-5-カルボン酸チオアミド 2. 85 gを得た。次いで、得られた 2-(2-メトキシカルボニルメチルフェニルイミノ)-[1, 3]オキサチオール-4-メチル-5-カルボン酸チオアミド 1. 2 g (3. 73 mmol) を N, N-ジメチルホルムアミド 15 ml に溶解し、次いで、1, 1, 1-トリフルオロ-3-プロモアセトン 0. 711 g (3. 73 mmol) を加え、室温にて 48 時間攪拌した。反応混合物に水 50 ml を加え、酢酸エチルにて抽出後、酢酸エチル層を、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフィー (n-ヘキサン：酢酸エチル 2 : 1) にて精製することにより、目的のメチル 2-(2-(アザ(3-(4-トリフルオロメチル-4-ヒドロキシチアゾリン-2-イル)-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸 220 mg を無色油状物として得た。

¹H NMR (CDCl₃, δ (ppm)) : 2.46(s, 3H), 3.11(s, 1H), 3.50(m, 1H), 3.66(s, 3H), 3.66(s, 2H), 3.66(m, 1H), 6.98-7.31(m, 4H)

〔実施例 4-4〕

メチル 2-(2-(アザ(3-(4-トリフルオロメチルチアゾール-2-イル)-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸 (本発明化合物II-428) の合成

実施例 4-3 にて得られた、メチル 2-(2-(アザ(3-(4-トリフルオロメチル-4-ヒドロキシチアゾリン-2-イル)-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸 200 mg (0. 46 mmol) をジクロロメタン 5 ml に溶解し、ビリジン 0. 182 g (2. 3 mmol) およびトリフルオロ酢酸無水物 0. 194 g (0. 92 mmol) を加え、還流下 2. 5 時間攪拌した。反応混合物を減圧下溶媒を留去し、得られた残渣を薄層シ

リカゲルクロマトグラフィー (n-ヘキサン : 酢酸エチル 3 : 1) にて精製することにより、目的のチル 2-(2-(アザ(3-(4-トリフルオロメチルアゾール-2-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸 0.15 g を得た。

融点 : 114-115°C

〔実施例 4-5〕

N-メチル 2-(2-(アザ(3-(2-フルオロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸アミド (本発明化合物II-463) の合成

メチル 2-(2-(アザ(3-(2-フルオロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸 1 g (2.35 mmol) をメタノール 40 ml に溶解し、次いで、40% メチルアミンメタノール溶液 1.83 g (23.5 mmol) を加え、室温にて 1 日間攪拌した。減圧下溶媒を留去し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム) にて精製することにより、目的の N-メチル 2-(2-(アザ(3-(2-フルオロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸アミド 0.9 g を無色油状物として得た。

屈折率 : $n_{D20.1} = 1.5632$

〔実施例 4-6〕

N-メチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)-6-メチルフェニル)酢酸アミド (本発明化合物No. IV-55) の合成

メチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)-6-メチルフェニル)酢酸 0.5 g (1.18 mmol) をメタノール 5 ml に溶解し、次いで、40% メチルアミンメタノール溶液 10 g (0.13 mol) を加え、室温にて一週間攪拌した。減圧下溶媒を留去し、得られた残渣を酢酸エチルに溶解した後、希塩酸および飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウム

にて乾燥し、ろ過後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジイソプロピルエーテルにて洗浄する事により、目的のN-メチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)-6-メチルフェニル)酢酸アミドを無色結晶として得た。

融点：m.p. 152-154°C

〔実施例47〕

N-メチル 2-(2-(アザ(3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)-6-メチルフェニル)酢酸アミド（本発明化合物II-568）の合成

N-メチル 2-(2-(((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-6-メチルフェニル)酢酸アミド 133mg (0.5mmol) を1mlのN, N-ジメチルホルムアミドに溶解し、これに2-ブロモ-1-(2,4-ジクロロフェニル)-1-エタノン 134mg (0.5mmol) を加え50°Cにて5時間加熱攪拌した。反応混合物に水5mlを加え酢酸エチルにて抽出した後、有機層を食塩水にて洗浄し、ついで無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン：酢酸エチル=1:2)にて精製した後、ジエチルエーテルにて洗浄することにより、目的のN-メチル 2-(2-(アザ(3-(2,4-ジクロロフェニル)-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)-6-メチルフェニル)酢酸アミド 0.1g を無色結晶として得た。

融点：m.p. 175-177°C

〔実施例48〕

N-メチル 2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸アミド（本発明化合物IV-65）の合成

N-メチル 2-(2-(((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸アミド 390mg (1.5mmol) を5mlのN, N-ジメチルホルムアミドに溶解し、これに2-ブロモ-1-(5-トリフルオロメチル-1

－メチルピラゾール－3－イル)－1－プロパン $4\ 3\ 0\ mg$ ($1.\ 5\ mmol$)を加え $50^{\circ}C$ にて6時間加熱攪拌した。反応混合物に水 $1\ 5\ ml$ を加え酢酸エチルにて抽出した後、有機層を食塩水にて洗浄し、ついで無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジイソプロピルエーテルにて洗浄することにより、目的のN－メチル－2－(2－(アザ(3－(5－トリフルオロメチル－1－メチルピラゾール－3－イル)－4－メチル－2，5－オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)酢酸アミド $0.\ 5\ 1\ g$ を無色結晶として得た。

融点： $m.p.$ $182-183^{\circ}C$

[実施例49]

メチル－2－(3－メチル－4－フェニル－3H－チアゾール－2－イリデンアミノ)－フェニル カーボネート(本発明化合物III-29)の合成

2－アミノフェノール $1.\ 2\ 5\ g$ ($1\ 0\ mmol$)をテトラヒドロフラン $2\ 0\ ml$ に溶解し、これにメチルイソチオシアネート $0.\ 7\ 3\ g$ ($1\ 0\ mmol$)、トリエチルアミン $1.\ 0\ 2\ g$ ($1\ 0\ mmol$)および触媒量の4－(ジメチルアミノ)－ビリジンを加え、室温にて3日間攪拌した。テトラヒドロフランを留去し、水 $5\ 0\ ml$ を加え、濃塩酸にてpHを4に調製した後、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジイソプロピルアルコールにて洗浄することにより、1－(2－ヒドロキシフェニル)－3－メチル－チオウレア $1.\ 2\ 5\ g$ を無色結晶として得た。

融点： $136^{\circ}C <$ (分解)

引き続き得られた、1－(2－ヒドロキシフェニル)－3－メチル－チオウレア $1\ g$ ($5.\ 5\ mmol$)を $5\ 0\ ml$ のテトラヒドロフランおよび $2\ ml$ のN，N－ジメチルホルムアミドに溶解し、これにフェナシルプロマイド $1.\ 1\ g$ ($5.\ 5\ mmol$)を加えた。 $80^{\circ}C$ にて5時間攪拌した後、溶媒を留去し、反応混合物に水 $5\ 0\ ml$ および1規定水酸化ナトリウム水溶液 $2\ 5\ ml$ を加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、ろ過し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジイソプロピルアルコ

ールにて洗浄することにより、2-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデンアミノ)-フェノール1. 3 gを無色結晶として得た。

融点：151-153°C

引き続き得られた、2-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデンアミノ)-フェノール0. 3 gアセトニトリル20mlに溶解し、無水炭酸カリウムおよびクロロ蟻酸メチルエステルを加え室温にて、16時間攪拌した。反応混合物に水300mlを加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、ろ過し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジイソプロピルアルコールにて洗浄することにより、メチル 2-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデンアミノ)-フェニル カーボネート0. 2 gを無色結晶として得た。

融点：112-113°C

〔実施例50〕

メチル (2-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデンアミノ) フェノキシ)-酢酸 (本発明化合物III-31) の合成

実施例49において得られた、2-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデンアミノ)-フェノール0. 7 gをアセトニトリル30mlに溶解し、無水炭酸カリウムおよびプロモ酢酸メチルエステルを加え室温にて、16時間攪拌した。反応混合物に水50mlを加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、ろ過し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル : n-ヘキサン = 2 : 3) にて精製し、目的のメチル (2-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデンアミノ) フェノキシ)-酢酸0. 1 gを無色結晶として得た。

融点：m.p. 119-121°C

〔実施例51〕

(E)-メチル (3-メトキシー-2-(2-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデンアミノ)-フェノキシ))-アクリル酸 (本発明化合物III-32) の合成

55%水素化ナトリウム 0.28 g (6.42 mmol) をヘキサンにて洗浄した後、N,N-ジメチルホルムアミドに懸濁させた。これに実施例50において得られた、メチル (2-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデンアミノ)フェノキシ)-酢酸 1 g (2.82 mmol) および蟻酸メチル 1.7 g (28.3 mmol) を加え、室温にて16時間攪拌した。反応混合物に無水炭酸カリウム 6.24 g (45.2 mmol) 次いでジメチル硫酸 0.89 g (7.06 mmol) を加えさらに室温にて2時間攪拌した。反応混合物を冰水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した、有機層を水および飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、ろ過後溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル : n-ヘキサン = 1 : 1) にて精製することにより目的の (E)-メチル (3-メトキシ-2-(2-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデンアミノ)フェノキシ)-アクリル酸 1 g を無色油状物として得た。

¹H NMR (CDCl₃, δ (ppm)) : 3.34(s, 3H), 3.65(s, 3H), 3.75(s, 3H), 5.77(s, 1H), 6.90-7.60(m, 10H)

【実施例52】

(2-アゼパン-1-イルメチルフェニル)-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデン)-アミン (本発明化合物III-43) の合成
 2-アミノベンジルアルコール 12.3 g (0.1 mol) をテトラヒドロフラン 100 ml に溶解し、トリエチルアミン 10.1 g (0.1 mol) およびメチルイソチオシアネート 7.3 g (0.1 mol) を加え、室温にて16時間攪拌した。溶媒を留去し、得られた残渣をN,N-ジメチルホルムアミド 100 ml に溶解しフェナシルプロマイド 19.9 g (0.1 mol) を加え室温にて16時間攪拌した。反応混合物にジエチルエーテル 300 ml を加え析出した結晶をろ取した。得られた結晶を水 100 ml に溶解し、2規定水酸化ナトリウム水溶液 100 ml を加え、析出した結晶をろ取した。得られた結晶を酢酸エチル 800 ml に溶解し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥、ろ過後減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジイソプロピルエーテルにて洗浄することにより、(2-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデンアミノ)フェ

ニル) - メタノール 21. 3 g を無色結晶として得た。

引き続き得られた、(2-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデンアミノ)-フェニル)-メタノール 2. 96 g (10 mmol) を塩化メチレン 100 ml に溶解し、5から10°Cにて、三臭化リン 2. 71 g (10 mmol) を加えた。反応混合物を室温まで昇温し、さらに16時間攪拌した後、ジエチルエーテル 300 ml を加え析出した結晶をろ取することにより(2-プロモメチルフェニル)-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデン)-アミン 5 g を無色結晶として得た。

引き続き得られた、(2-プロモメチルフェニル)-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデン)-アミン 0. 44 g (2 mmol) をヘキサメチレンイミン 200 mg (2 mmol)、N,N-ジジメチルホルムアミド 5 ml および無水炭酸カリウム 276 mg (2 mmol) の混合物に加えた。室温にて16時間攪拌した後、水 20 ml を加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を水および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、ろ過し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジイソプロピルエーテルおよびジエチルエーテルの混合液にて洗浄することにより、目的の(2-アゼパン-1-イルメチルフェニル)-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデン)-アミン 0. 19 g を無色結晶として得た。

融点：88-90°C

〔実施例 53〕

(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデン)-(2-(5-トリフルオロメチル-[1,3,4]オキサジアゾール-2-イルメチル)-フェニル)-アミン (本発明化合物III-44) の合成

実施例1により得られた、メチル 2-(2-(アザ(5-メチル-4-フェニル-2,5-チアゾリニリデン)メチル)フェニル)酢酸 2. 03 g (6 mmol) を水 10 ml に懸濁し、これにヒドラジン 1 水和物 2. 4 g (4.8 mmol) を加え加熱還流した。50時間後、反応混合物を酢酸エチルにて抽出し、有機層を水および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、ろ過し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジエチルエーテルにて洗浄すること

により、2-(2-(アザ(5-メチル-4-フェニル-2,5-チアゾリニリデン)メチル)フェニル)酢酸ヒドラジド0.7gを無色結晶として得た。

引き続き得られた、(2-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデンアミノ)-フェニル)酢酸ヒドラジド0.8g(2.4mmol)を塩化メチレン10mlに溶解し、これに、トリフルオロ酢酸無水物504mg(2.4mmol)を加えた。室温に3時間攪拌し、減圧下溶媒を留去した後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル)にて精製し、得られた残渣をジエチルエーテルおよびジイソプロピルエーテルにて洗浄することにより、N'-(2-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデンアミノ)-フェニル)アセトトリフルオロアセトヒドラジド0.58gを無色結晶として得た。

引き続き得られた、N'-(2-(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデンアミノ)-フェニル)アセトトリフルオロアセトヒドラジド0.4g(0.84mmol)を1,2-ジクロロエタン10mlに溶解し、これに、オキシ塩化リン1.6mlを加え室温にて、2時間攪拌した。減圧下溶媒を留去し、得られた残渣に水20mlを加えた。2規定水酸化ナトリウム水溶液にてpH12に調製した後、酢酸エチルにて抽出した。有機層を水および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム)にて精製し、ジイソプロピルエーテルにて洗浄することにより目的の、(3-メチル-4-フェニル-3H-チアゾール-2-イリデン)-(2-(5-トリフルオロメチル-[1,3,4]オキサジアゾール-2-イルメチル)-フェニル)-アミン0.19gを無色結晶として得た。

融点；171-172°C

〔実施例54〕

(2-(4-(2,6-ジフルオロフェニル)-5-メチル-[1,3]ジチオール-2-イリデンアミノ)-フェニル)-フェニルメタノンO-メチルオキシム(本発明化合物II-259)の合成

(2-アミノフェニル)-フェニルメタノン10g(51mmol)、メ

トキシアミン塩酸塩 8.4 g (1.02 mmol)、酢酸ナトリウム 8.3 g (1.02 mmol)、水 20 mL およびエタノール 150 mL の混合物を還流下、5 日間攪拌した。不溶物をろ過し、ろ液を減圧下留去後、水 50 mL を加えた。析出した結晶をジイソプロピルエーテルにて洗浄することにより、(2-アミノフェニル)-フェニルメタノン-O-メチルオキシム 7 g を無色結晶として得た。

引き続き得られた (2-アミノフェニル)-フェニルメタノン-O-メチルオキシム 0.5 g (2.21 mmol) および参考例 2-2 により得られた (4-(2,6-ジフルオロフェニル)-5-メチル-[1,3]ジチオール-2-イリデン)-ジメチルアンモニウム 硫酸塩 0.816 g (2.21 mmol) を 1,2-ジクロロエタンに溶解し、これにトリエチルアミン 0.448 g (4.42 mmol) を加え、還流下、1 時間攪拌した。さらに、(4-(2,6-ジフルオロフェニル)-5-メチル-[1,3]ジチオール-2-イリデン)-ジメチルアンモニウム 硫酸塩 0.5 g およびトリエチルアミン 0.5 g を加え、還流下、1 時間攪拌した。反応混合物に 3 規定塩酸を加えジエチルエーテルにて抽出した。有機層を 3 規定塩酸、次いで飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を分取薄層クロマトグラフィー (酢酸エチル : n-ヘキサン = 1 : 9) にて精製することにより、目的の (2-(4-(2,6-ジフルオロフェニル)-5-メチル-[1,3]ジチオール-2-イリデンアミノ)-フェニル)-フェニルメタノン-O-メチルオキシム 3.84 mg を淡黄色油状物として得た。

¹H NMR (CDCl₃, δ (ppm))

1.95(s, 3H), 3.95(s, 3H), 6.85-7.60(m, 12H)

[実施例 5-5]

2-メチル-5-メチルメルカプト-4-(2-(アザ(3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)-2,4-ジヒドロ-1,2,4-トリアゾール-3-オン (本発明化合物 II-596) の合成

国際出願公開 WO 95/14009 号記載の方法を参考に、2-ニトロフェニ

ルイソシアネート 2 g (12.2 mmol) を 1, 2-ジクロロエタン 20 ml に溶解し、次いで 0 °C にて 5 ml の 1, 2-ジクロロエタンに溶解したメチルヒドラジン 0.67 g (14.6 mmol) を加えた。室温にて 16 時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去することにより、1-(2-ニトロフェニル)-3-メチルセミカルバジド 2.59 g を淡黄色油状物として得た。

引き続き得られた 1-(2-ニトロフェニル)-3-メチルセミカルバジド 0.76 g (3.62 mmol) をテトラヒドロフラン 30 ml に溶解し、氷浴にて冷却した。次いでチオホスゲン 0.42 g (3.62 mmol) およびトリエチルアミン 0.73 g (7.24 mmol) を加え室温にて 16 時間攪拌した。不要物をろ別後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をテトラヒドロフラン 10 ml に溶解し、これを水素化ナトリウム 0.43 g (10 mmol) の 10 ml テトラヒドロフラン懸濁液に滴下した。次いで、ヨウ化メチル 2.13 g (1.5 mmol) を加えた後、室温にて 16 時間攪拌した。反応混合物に希塩酸を加え酸性とした後、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水および食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) にて精製することにより、4-(2-ニトロフェニル)-2-メチル-5-メチルメルカプト-2, 4-ジヒドロ-1, 3, 4-トリアゾール-3-オン 0.58 g を黄色結晶として得た。

引き続き得られた 4-(2-ニトロフェニル)-2-メチル-5-メチルメルカプト-2, 4-ジヒドロ-1, 3, 4-トリアゾール-3-オン 0.3 g (1.13 mmol) を酢酸 10 mg および酢酸エチル 10 ml の混合溶媒に溶解し、これを 70 °C にて鉄粉 0.63 g (11.3 mmol) 、酢酸 1 ml および酢酸エチル 2 ml の懸濁液に滴下した。70 °C にて 30 分攪拌後、室温まで冷却し、水 20 ml を加え酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣に、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1, 3-オキサチオール-2-イリデンジメチルアンモニウム 臭化水素酸塩 0.77 g (2.1 mmol) および 1, 2-ジクロロエタン 10 ml を加

え、1時間加熱還流した。引き続き室温にて16時間攪拌した後さらに1.5時間加熱還流した。反応混合物に水を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水および食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（n-ヘキサン：酢酸エチル=1:1）にて精製することにより、目的の2-メチル-5-メチルメルカブト-4-（2-（アザ（3-（4-トリフルオロメチルフェニル）-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン）メチル）フェニル）-2,4-ジヒドロ-1,2,4-トリアゾール-3-オン460mgを淡黄色油状物として得た。

〔実施例56〕

メチル 2-（アザ（3-（5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル）-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン）メチル）フェニルカルバミン酸（本発明化合物IV-83）の合成

2-（（ジメチルアミノ）チオキソメチル）アミノ）-ニトロベンゼン1g（4.4mmol）、2-ブロモ-1-（5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル）-1-プロパノン1.26g（4.4mmol）およびN,N-ジメチルホルムアミド20mlの混合溶液を100°Cにて8時間加熱攪拌した。反応混合物に水20mlを加え酢酸エチルにて抽出した後、有機層を食塩水にて洗浄し、ついで無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（n-ヘキサン：酢酸エチル=3:1）にて精製することにより、2-（アザ（3-（5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル）-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン）メチル）ニトロベンゼン1.5gを無色結晶として得た。

融点：77.5-78°C

引き続き得られた2-（アザ（3-（5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル）-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン）メチル）ニトロベンゼン1.5g（3.91mmol）をメタノール35mlに溶解し、室温にて塩化第一銅1.2g（12mmol）および水素化ホウ素カリウム1.47g（27mmol）を加えた。室温にて1時間攪拌した後、さらに室温にて

塩化第一銅 1. 2 g (1.2 mmol) および水素化ホウ素カリウム 1. 47 g (2.7 mmol) を加えた。室温にて1時間攪拌した後、さらに塩化第一銅 1. 2 g (1.2 mmol) および水素化ホウ素カリウム 1. 47 g (2.7 mmol) を加えた。引き続き室温にて1時間攪拌した後、反応混合物をセライトろ過し、ろ液に水 50 ml を加え酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより 2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン)メチル)アニリンを無色結晶（融点：68-69°C）として得た。引き続き得られた 2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン)メチル)アニリンをジクロロメタン 20 ml に溶解し、次いでピリジン 0. 2 g (2. 5 mmol) およびクロロギ酸メチル 0. 2 g (2. 1 mmol) を加え、室温にて1時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン : 酢酸エチル = 10 : 1) にて精製することにより、目的のメチル 2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニルカルバミン酸 0. 45 g を黄色油状物として得た。

¹H NMR (CDCl₃, δ (ppm)) : 2.40 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.05 (s, 3H), 6.92 (s, 1H), 7.02 (t, J=7.6Hz, 1H), 7.11 (d, J=8.0Hz, 1H), 7.16 (t, J=7.6Hz, 1H), 7.47 (br, 1H), 8.18 (d, J=7.2Hz, 1H)

[実施例 57]

メチル 2-(アザ(3-(4-メチルフェニル)-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニルカルバミン酸（本発明化合物II-469）の合成

2-(((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-ニトロベンゼン 1.0 g (4.4. 4 mmol) を 1, 4-ジオキサン 80 ml に溶解し、これに 2-ブロモ-1-(4-メチルフェニル)-1-プロパン 1.0. 6 g (4.6. 6 mmol) を加え、加熱還流下 2 日間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、減圧下溶媒を留去し、析出した結晶を水およびジイソプロピルエーテルにて洗浄

する事により、2-(アザ(3-(4-メチルフェニル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)ニトロベンゼン12gを無色結晶として得た。

引き続き得られた2-(アザ(3-(4-メチルフェニル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)ニトロベンゼン5g(15.3mmol)をメタノール120mlに溶解し、室温にて塩化第一銅22.8g(230mmol)および水素化ホウ素カリウム29g(537mmol)を5回に分けて少量ずつ加えた。反応混合物をセライトおよびシリカゲルにてろ過し、ろ液に水および飽和アンモニア水を加え酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水洗後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、ついでシリカゲルろ過した後、減圧下溶媒を留去することにより2-(アザ(3-(4-メチルフェニル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)アニリンを得た。

引き続き得られた2-(アザ(3-(4-メチルフェニル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)アニリン0.2g(0.68mmol)をジクロロメタン3mlに溶解し、次いでピリジン64mg(0.81mmol)およびクロロギ酸メチル70mg(0.74mmol)を加え、室温にて30分間攪拌した後、水を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を1規定塩酸および食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフィー(n-ヘキサン:クロロホルム=1:9)にて精製することにより、目的のメチル2-(アザ(3-(4-メチルフェニル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニルカルバミン酸0.15gを無色結晶として得た。

融点：104-106℃

[実施例58]

メチル(メトキシメチル(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル))カルバミン酸(本発明化合物IV-89)の合成

メチル(メトキシメチル(2-(((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル))カルバミン酸294mg(0.99mmol)、2-ブロモ

- 1 - (5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル) - 1 - プロパノン 282 mg (0. 99 mmol) および N, N-ジメチルホルムアミド 3 ml の混合溶液を 50 °C にて 3 時間加熱攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフィー (n-ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 2) にて精製することにより、目的のメチル (メトキシメチル (2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン) メチル) フェニル)) カルバミン酸 0. 3 g を無色結晶として得た。

融点 : 100 - 103 °C

〔実施例 59〕

メチル (2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン) メチル) - 6-メチルフェニル) カルバミン酸 (本発明化合物 IV-93) の合成

メチル (メトキシメチル (2-((ジメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ) - 6-メチルフェニル) カルバミン酸 0. 5 g (1. 6 mmol)、2-ブロモ-1-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル) - 1-プロパノン 458 mg (1. 6 mmol) および N, N-ジメチルホルムアミド 2 ml の混合溶液を 50 °C にて 2 時間加熱攪拌した。反応混合物を室温まで冷却した後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフィー (n-ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 2) にて精製することにより、メチル (メトキシメチル (2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン) メチル) - 6-メチルフェニル)) カルバミン酸 0. 595 g を無色結晶として得た。引き続き得られた、メチル (メトキシメチル (2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン) メチル) - 6-メチルフェニル)) カルバミン酸 0. 595 g (1. 27 mmol) をジクロロメタン 4 ml に溶解し、氷浴にて冷却した後、三臭化ホウ素 0. 18 ml (1. 9 mmol) を加え、室温にて 16 時間攪拌した。さらに、三臭化ホウ素 0. 2 ml (2. 1 mmol) を加え、室温に

て3時間攪拌した後、ジクロロメタン4mlを加え、氷浴にて冷却した。トリエチルアミン3g(3.0mmol)を加えた後、反応混合物を氷水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を薄層シリカゲルクロマトグラフィー(n-ヘキサン:酢酸エチル=3:2)にて精製することにより、2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)-6-メチルアニリン0.17gを得た。引き続き得られた、2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)-6-メチルアニリン0.17g(0.46mmol)をジクロロメタン3mlに溶解し、次いでピリジン44mg(0.55mmol)およびクロロギ酸メチル48mg(0.5mmol)を加え、室温にて30分間攪拌した後、水を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を1規定塩酸および食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより、目的のメチル(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)-6-メチルフェニル)カルバミン酸0.17gを無色結晶として得た。

融点: 55-58°C

[実施例60]

(E)-メチル2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)-3-メトキシ-2-プロペン酸(本発明化合物IV-91)の合成

2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)ヨードベンゼン1.5g(3.2mmol)、テトラキストリフェニルホスフィン0.2g(0.1mmol)およびテトラヒドロフランの混合溶液に、テトラヘドロン(Tetrahedron)第54巻、7595頁(1998年)記載の方法により得られた、0.79M(Z)-2-メトキシ-1-(メトキシカルボニル)エテニ

ルジンクヨージド TMEDA 錫体 1.5 ml を加え 60℃にて 2 時間攪拌した後、引き続き室温にて 16 時間攪拌した。さらに、60℃にて 5 時間攪拌した後、反応混合物を飽和塩化アンモニウム水溶液に注ぎジエチルエーテルにて抽出した。ジエチルエーテル層を食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) にて精製することにより得られた結晶を、ジエチルエーテルおよびジイソプロピルエーテルにて洗浄する事により、目的の (E)-メチル-2-(2-(アザ(3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)-3-メトキシ-2-プロペン酸 0.6 g を無色結晶として得た。

融点 : 140 - 142℃

〔実施例 61〕

2-メチル-5-メチルスルホニル-4-(2-(アザ(3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)-2,4-ジヒドロ-1,2,4-トリアゾール-3-オン(本発明化合物 II-600)の合成

実施例 55 にて得られた 4-(2-ニトロフェニル)-2-メチル-5-メチルメルカプト-2,4-ジヒドロ-1,3,4-トリアゾール-3-オン 1 g (3.76 mmol) を、酢酸 20 ml に溶解し、ついで 35% 過酸化水素水溶液 5 ml を加え 80℃にて、2 時間攪拌した。反応混合物に水を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を、水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することにより、4-(2-ニトロフェニル)-2-メチル-5-メチルスルホニル-2,4-ジヒドロ-1,3,4-トリアゾール-3-オン 0.96 g を淡黄色油状物として得た。

引き続き得られた 4-(2-ニトロフェニル)-2-メチル-5-メチルスルホニル-2,4-ジヒドロ-1,3,4-トリアゾール-3-オン 0.3 g (1 mmol) を酢酸 10 ml および酢酸エチル 10 ml の混合溶媒に溶解したも

のを、70°Cにて、鉄粉0.56g(1.0mmol)、酢酸1m1および酢酸エチル2m1の懸濁液に滴下した。滴下終了後、反応混合物を室温まで冷却し、水を加えた後、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を、水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することにより、4-(2-アミノフェニル)-2-メチル-5-メチルスルホニル-2, 4-ジヒドロ-1, 3, 4-トリアゾール-3-オン0.15gを無色結晶として得た。引き続き得られた、4-(2-アミノフェニル)-2-メチル-5-メチルスルホニル-2, 4-ジヒドロ-1, 3, 4-トリアゾール-3-オン0.15g(0.56mmol)をジクロロエタンに溶解し、これに参考例24にて得られた(4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-5-メチル-[1, 3]オキサチオール-2-イリデン)-ジメチルアンモニウム臭化水素酸塩0.42g(1.1mmol)を加え、3時間加熱還流した。引き続き反応混合物を室温にて終夜攪拌した後、さらに3時間加熱還流した。反応混合物に水を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を、食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を分取薄層クロマトグラフィー(酢酸エチル:n-ヘキサン=1:3~3:2)にて精製することにより、目的の2-メチル-5-メチルスルホニル-4-(2-(アザ(3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)-2, 4-ジヒドロ-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン0.17gを淡黄色油状物として得た。

¹H NMR (CDCl₃, δ (ppm)) : 2.28(s, 3H), 3.20(s, 3H), 3.60(s, 3H), 7.25-7.75(m, 8H)

〔実施例62〕

2-メチル-5-メトキシ-4-(2-(アザ(3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-4-メチル-2, 5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)-2, 4-ジヒドロ-1, 2, 4-トリアゾール-3-オン(本発明化合物II-601)の合成

ナトリウムメトキシドの23%メタノール溶液3.69g(0.9mmol)および1, 2-ジメトキシエタンの混合溶液に、実施例61にて得られた、4-

(2-ニトロフェニル)-2-メチル-5-メチルスルホニル-2,4-ジヒドロ-1,3,4-トリアゾール-3-オン 0.5 g (1.68 mmol) を加え、2時間加熱還流した後、引き続き室温にて終夜攪拌した。さらに、6.5時間加熱還流した後、ナトリウムメトキシドの23%メタノール溶液1mlを加え、0.5時間加熱還流した。反応混合物を室温まで冷却し、水および希塩酸を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を、食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を分取薄層クロマトグラフィー（酢酸エチル：n-ヘキサン=2:1~4:1）にて精製することにより、4-(2-ニトロフェニル)-2-メチル-5-メトキシ-2,4-ジヒドロ-1,3,4-トリアゾール-3-オン 0.19 g を淡黄色油状物として得た。

引き続き得られた4-(2-ニトロフェニル)-2-メチル-5-メトキシ-2,4-ジヒドロ-1,3,4-トリアゾール-3-オン 0.19 g (0.76 mmol) を酢酸5mlおよび酢酸エチル5mlの混合溶媒に溶解したものと、70°Cにて、鉄粉0.42 g (7.6 mmol)、酢酸1mlおよび酢酸エチル2mlの懸濁液に滴下した。滴下終了後、反応混合物を室温まで冷却し、水を加えた後、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を、水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することにより、4-(2-アミノフェニル)-2-メチル-5-メトキシ-2,4-ジヒドロ-1,3,4-トリアゾール-3-オン 0.08 g を無色結晶として得た。引き続き得られた、4-(2-アミノフェニル)-2-メチル-5-メトキシ-2,4-ジヒドロ-1,3,4-トリアゾール-3-オン 0.08 g (0.36 mmol) をジクロロエタン5mlに溶解し、これに参考例24にて得られた(4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-5-メチル-[1,3]オキサチオール-2-イリデン)-ジメチルアンモニウム臭化水素酸塩0.27 g (0.72 mmol) を加え、3時間加熱還流した。反応混合物に水を加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を、食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を分取薄層クロマトグラフィー（酢酸エチル：n-ヘキサン=1:1）にて精製すること

により、目的の 2-メチル-5-メトキシ-4-(2-(アザ(3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン)メチル)フェニル)-2,4-ジヒドロ-1,2,4-トリアゾール-3-オン 0.18 g を淡黄色油状物として得た。

¹H NMR (CDCl₃, δ (ppm)) : 2.28(s, 3H), 3.40(s, 3H), 3.90(s, 3H), 7.25-7.75(m, 8H)

[参考例 1]

メチル 2-(2-((メチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸の合成

2-(2-ニトロフェニル)酢酸 18 g (0.1 mol) をメタノール 400 ml に溶解し、これに濃硫酸 5 ml を加えた後、3 時間加熱還流した。メタノールを留去した後、冰水 100 ml を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。ろ過後、溶媒を留去することにより、メチル 2-(2-ニトロフェニル)酢酸を無色油状物として 20 g 得た。

続いて、得られたメチル 2-(2-ニトロフェニル)酢酸 15 g (7.5 mmol) をメタノールに溶解し、これに 5% パラジウム-活性炭 0.5 g を加えた後、水素雰囲気下室温にて 3 時間攪拌した。パラジウム-活性炭をろ別後、減圧下メタノールを留去することによりメチル 2-(2-アミノフェニル)酢酸 1.2.3 g を淡黄色油状物として得た。

続いて、得られたメチル 2-(2-アミノフェニル)酢酸 7 g (4.2.4 mol) を無水テトラヒドロフラン 40 ml に溶解し、これにイソチオシアノ酸メチル 3.1 g (4.2.4 mmol)、トリエチルアミン 4.3 g (4.2.4 mol) および 4-ジメチルアミノビリジン 0.5 g を加え、室温にて攪拌した。96 時間後、減圧下溶媒を留去し、得られた反応混合物に水 50 ml を加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を 1 N 塩酸にて洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去し得られた残渣を、ジエチルエーテルおよびジイソプロピルエーテルの混合溶媒にて洗浄することによりメチル 2-(2-((メチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸 6.5

g を無色結晶として得た。

融点； 99 - 100 °C

[参考例 2]

トリエチルアンモニウム 2-(2-メトキシ-2-オキソエチル) フェニルカルバモジチオエートの合成

メチル 2-(2-アミノフェニル) 酢酸 60.4 g (0.37 mol) のベンゼン (120 ml) 溶液を氷冷し、二硫化炭素 27.9 g (0.37 mol) およびトリエチルアミン 37.1 g (0.37 mol) を加え、冷蔵庫で1週間静置した。反応液を室温に戻し、ジエチルエーテル 200 ml を加え、30分間攪拌した。析出した結晶を沈殿させ、上澄み液を除去し、再びジエチルエーテル 200 ml を加えて30分間攪拌した。結晶を減圧下でろ過し、減圧乾燥することにより目的のトリエチルアンモニウム 2-(2-メトキシ-2-オキソエチル) フェニルカルバモジチオエート 117 g を淡黄色結晶として得た。

[参考例 3]

メチル 2-(2-イソチオシアネートフェニル) 酢酸の合成

トリエチルアンモニウム 2-(2-メトキシ-2-オキソエチル) フェニルカルバモジチオエート 90 g (0.26 mol)、トリエチルアミン 26.6 g (0.26 mol) およびクロロホルム 200 ml の混合液を氷冷し、クロロギ酸エチル 28.6 g (0.26 mol) を加えた。反応液を室温に戻し、さらに1、5時間攪拌した。反応液に1規定水酸化ナトリウム水溶液 300 ml を加え、有機層と水層を分離し、水層をクロロホルムにて抽出し、先の有機層に加えた。この有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、ろ過し、減圧下で溶媒を留去することにより目的のメチル (2-イソチオシアネートフェニル) 酢酸 55.8 g を淡黄色油状物として得た。

屈折率； n_D 21.41.5032

[参考例 4]

メチル 2-(((メチルイミノ)メチレン)アミノ) フェニル) 酢酸の合成

メチル 2-(((メチルアミノ)チオキソメチル)アミノ) フェニル

) 酢酸 2. 38 g (10 mmol)、トリエチルアミン 3. 03 g (30 mmol) および 4-(ジメチルアミノ)ピリジン 50 mg (0. 4 mmol) をクロロホルム 100 ml に溶解し、そこに 25°C 以下でメタンスルホニルクロライド 2. 29 g (20 mmol) を滴下した。室温で 1 時間攪拌した後、反応液を水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、ろ過し、溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム）にて精製することにより目的のメチル 2-(2-((ジメチルアミノ)メチレン)アミノ)フェニル酢酸 1. 5 g を淡黄色油状物として得た。

屈折率 ; n_{D21} 1.5032

〔参考例 5〕

メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル酢酸の合成

メチル 2-(2-イソチオシアネートフェニル)酢酸 5 g (24. 2 mmol) のテトラヒドロフラン 50 ml 溶液を氷冷し、ジメチルアミン (40% 水溶液) 2. 8 g (24. 8 mmol) を加えた。反応液を室温に戻し、さらに 30 分間攪拌した後、溶媒を減圧留去し、析出した結晶をジエチルエーテルにて洗浄し、減圧乾燥することにより目的のメチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル酢酸 4. 9 g を無色結晶として得た。

融点 ; 110-113°C

〔参考例 6〕

メチル 2-(2-(1-アザ-2-(2, 2-ジメチル-2-シラプロピルチオ)-2-メチルチオビニル)フェニル)酢酸（化合物VII-30）の合成

メチル 2-(2-イソチオシアネートフェニル)酢酸 2. 9 g (14 mmol) およびトリメチルシリルメタンチオール 1. 68 g (14 mmol) をエタノール 20 ml に溶解した後、触媒量の 1, 8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデク-7-エンを加え、室温で 1 時間攪拌した。反応終了後、溶媒を減圧留去し、水を加えた。クロロホルムにて抽出し、有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、ろ過し、溶媒を減圧留去することにより目的とするメチル 2-(2-((2, 2-ジメチル-2-シラプロピルチオ)-2-

－メチルチオビニル) フェニル) 酢酸 4. 75 g を粗精製物として得た。

得られた粗精製物をアセトン 20 ml に溶解し、氷冷下で炭酸カリウム 2. 32 g (16. 8 mmol) およびメチル トリフルオロメタンスルホン酸 4. 60 g (28 mmol) を加え、氷冷下で 2 時間攪拌した。反応終了後、溶媒を減圧留去した後、水を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、ろ過し、溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン : 酢酸エチル = 5 : 1) にて精製することにより目的のメチル 2-(2-(1-アザ-2-(2, 2-ジメチル-2-シラプロピルチオ)-2-メチルチオビニル) フェニル) 酢酸 4. 5 g を無色油状物として得た。

屈折率 : $n_{D21.0} 1.5676$

[参考例 7]

メチル 2-(2-(1-アザ-2-(2-ヒドロキシ-2-フェニルエチルチオ)-2-メチルチオビニル) フェニル) 酢酸 (化合物VII-31) の合成

メチル 2-(2-(1-アザ-2-(2, 2-ジメチル-2-シラプロピルチオ)-2-メチルチオビニル) フェニル) 酢酸 1. 03 g (3 mmol) 、ベンズアルデヒド 3. 18 g (30 mmol) およびフッ化セシウム 0. 92 g (6. 1 mmol) を N, N-ジメチルホルムアミド (6 ml) に溶解し、窒素雰囲気下、室温で 3 日間攪拌した。反応終了後、反応液に水を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、ろ過し、溶媒を減圧留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) にて精製することによりメチル 2-(2-(1-アザ-2-(2-ヒドロキシ-2-フェニルエチルチオ)-2-メチルチオビニル) フェニル) 酢酸 0. 3 g を得た。

[参考例 8]

メチル 2-(2-(((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-4-エチルフェニル) 酢酸の合成

水 150 ml および濃塩酸 100 ml の混合液に、硝酸ナトリウム 15 g (176 mmol) を加え、次いで市販の 4-エチルフェノール 20 g (164 mm

o 1) をジクロロメタン 150 ml およびジエチルエーテル 300 ml の混合溶媒に溶解したものをゆっくりと加えた。さらに反応混合物に無水酢酸 1.5 ml を加え、室温にて、5 時間攪拌した。反応混合物を酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、ろ過後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（n-ヘキサン：酢酸エチル = 9 : 1）にて精製することにより、4-エチル-2-ニトロフェノール 20.7 g を得た。

引き続き、得られた 4-エチル-2-ニトロフェノール 16.8 g (0.1 mol) およびピリジン 9.54 g (0.12 mol) をジクロロメタン 200 ml に溶解し、氷冷下、トリフルオロメタンスルホン酸無水物 31 g (0.11 mol) をゆっくりと加えた。反応混合物を室温まで昇温し、さらに 2 時間攪拌した後、水および飽和食塩水にて洗浄した。有機層を無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、ろ過し、減圧下溶媒を留去することにより、トリフルオロメタンスルホン酸（4-エチル-2-ニトロフェニル）エステル 29 g を得た。

55% 水素化ナトリウム 9.7 g (0.22 mol) をヘキサンにて洗浄後、N, N-ジメチルホルムアミド 220 ml に懸濁し、氷冷下、マロン酸ジメチル 32 g (0.24 mol) を加えた。反応混合物を 45℃ まで昇温し、1 時間攪拌した。次いで、トリフルオロメタンスルホン酸（4-エチル-2-ニトロフェニル）エステル 29 g (97 mmol) を N, N-ジメチルホルムアミド 30 ml に溶解したものを滴下し、さらに 45~50℃ にて 3 時間加熱攪拌した。次いで、反応混合物を室温まで冷却した後、さらに 12 時間攪拌した。反応混合物を水 250 ml に注ぎ、濃塩酸を加え溶液を酸性に調整した後、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより、2-(4-エチル-2-ニトロフェニル)マロン酸ジメチル 42.5 g を得た。

引き続き、得られた 2-(4-エチル-2-ニトロフェニル)マロン酸ジメチル 42.5 g を酢酸 150 ml および濃塩酸 150 ml の混合溶媒に溶解し、還流下 3 時間攪拌した。反応混合物を冰水に注ぎ、析出した結晶をろ取した。得られた結晶を酢酸エチルに溶解後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、ろ過後、減

圧下溶媒を留去した。得られた残渣をメタノール 200 ml に溶解し、濃硫酸 2 ml を加えた後、還流下 1 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を酢酸エチルに溶解し、水および飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去することによりメチル 2-(4-エチル-2-ニトロフェニル) 酢酸 17.6 g を得た。

引き続き得られた 2-(4-エチル-2-ニトロフェニル) 酢酸メチル 16 g (71.7 mmol) を酢酸エチルに溶解し、これに 5% パラジウム-活性炭 0.5 g を加えた。水素雰囲気下室温にて 4 時間攪拌後、パラジウム-活性炭をろ別した。得られたろ液を氷冷し、チオホスゲン 5.6 ml (73 mmol) を加えた後、70~80°C にて 2 時間攪拌した。次いで、反応混合物を氷冷し、さらに、50% ジメチルアミン水溶液 20 g (222 mmol) を加えた。反応混合物を室温まで昇温し、さらに 3 時間攪拌した後、水および濃塩酸を加え酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、ろ過後、減圧下溶媒を留去した。析出した結晶をジエチルエーテルにて洗浄する事により、メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-4-エチルフェニル) 酢酸 11.5 g を得た。

融点 : 109-111°C

また、原料として、4-エチルフェノールの代わりに、相当するフェノールを用いることにより、以下の化合物も同様に合成した。

メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-4-t-ブチルフェニル) 酢酸

融点 : 125-127°C

メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-4-プロピルフェニル) 酢酸

融点 : 73-75°C

メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-4-i-プロピルフェニル) 酢酸

融点 : 112-115°C

メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-4-

6 - ジメチルフェニル) 酢酸

¹H NMR (CDCl₃, δ (ppm)) : 2.29(s, 3H), 2.33(s, 3H), 3.39(s, 6H), 3.63(s, 2H), 3.70(s, 3H), 6.88(s, 1H), 7.21(s, 1H), 8.21(s, 1H)

[参考例 9]

メチル 2 - (2 - ((ジメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ) - 4 - メチルフェニル) 酢酸の合成

2 - クロロ - 5 - メチルニトロベンゼン 25.73 g (0.15 mol)、マロン酸ジメチル 43.56 g (0.33 mol)、炭酸カリウム 68.31 g (0.495 mol) および N, N - ジメチルホルムアミド 330 ml の混合物を 100°C にて 12 時間加熱攪拌した。反応混合物を水 330 ml に注ぎ、濃塩酸 75 ml を加え pH 2 に調整した。析出した結晶をろ取し、得られた結晶を酢酸エチルに溶解した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより、2 - (2 - ニトロ - 4 - メチルフェニル) マロン酸ジメチル 34.9 g を得た。

引き続き得られた、2 - (2 - ニトロ - 4 - メチルフェニル) マロン酸ジメチル 34.9 g をエタノール 165 ml に溶解し、次いで 4 規定水酸化ナトリウム水溶液を加え 60°C にて 90 分間攪拌した。減圧下エタノールを留去し、次いで水 100 ml および濃塩酸 65 ml を加え pH 2 に調整した後、さらに還流下 1 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、析出した結晶をろ取した。得られた結晶を酢酸エチルに溶解した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより、2 - (2 - ニトロ - 4 - メチルフェニル) 酢酸 18.2 g を得た。

2 - (2 - ニトロ - 4 - メチルフェニル) 酢酸 36.8 g (189 mmol) をメタノール 500 ml に溶解し、濃硫酸 6.5 ml を加えた後、還流下 1 時間攪拌した。メタノールを留去した後、氷水 100 ml を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。ろ過後、溶媒を留去することにより、2 - (2 - ニトロ - 4 - メチルフェニル) 酢酸メチル 38.2 g を得た。

引き続き得られた 2 - (2 - ニトロ - 4 - メチルフェニル) 酢酸メチル 38.

2 g (183 mmol) をメタノール 300 ml に溶解し、これに 5% パラジウム-活性炭 0.5 g を加えた。水素雰囲気下室温にて 4 時間攪拌後、パラジウム-活性炭をろ別した。得られたろ液を減圧下溶媒を留去し、残渣を酢酸エチルに溶解し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより 2-(2-アミノ-4-メチルフェニル) 酢酸メチル 32.5 gを得た。

2-(2-アミノ-4-メチルフェニル) 酢酸メチル 0.76 g (4.25 mmol) を N,N-ジメチルホルムアミド 12.5 ml に溶解し、これに 1,1-チオカルボニルジイミダゾール 0.81 g (4.54 mmol) を加え、室温にて 1 時間攪拌した。次いで、40% ジメチルアミン水溶液 0.5 g (4.44 mmol) を加えさらに室温にて 1 時間攪拌した。反応混合物を減圧下溶媒を留去し、得られた残渣に水 50 ml を加え酢酸エチルにて抽出した。有機層を 1N 塩酸にて洗浄した後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。ろ過後、減圧下溶媒を留去することによりメチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-4-メチルフェニル) 酢酸 1.1 g を無色結晶として得た。

融点：97-98°C

また、原料として、2-クロロ-5-メチルニトロベンゼンの代わりに、相当する 2-ハロゲノニトロベンゼンを用いることにより、以下の化合物も同様に合成した。

メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-3-フルオロフェニル) 酢酸

融点：145-148°C

メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-4-フルオロフェニル) 酢酸

融点：93-94°C

メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-4-トリフルオロフェニル) 酢酸

融点：87-90°C

メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-4-メトキシフェニル) 酢酸

¹H NMR (CDCl₃, δ (ppm)) : 2.29(s, 3H), 2.33(s, 3H), 3.39(s, 6H), 3.63(s, 2H), 3.70(s, 3H), 6.88(s, 1H), 7.21(s, 1H), 8.21(s, 1H)

[参考例 10]

メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-6-メチルフェニル)酢酸の合成

パラホルムアルデヒド 9.9 g (0.33 mmol) および 85% 水酸化カリウム 1.44 g をジメチルスルホキシド 50 ml に溶解し、ついで、2、3-ジメチルニトロベンゼン 16.5 g (0.11 mmol) をジメチルスルホキシド 50 ml に溶解したものを加えた。さらに 15 分おきに 85% 水酸化カリウム 1.44 g を 4 回に分けて加えた後、水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水洗し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより、2-(2-ニトロ-6-メチルフェニル)エチルアルコール 19.4 gを得た。

引き続き得られた 2-(2-ニトロ-6-メチルフェニル)エチルアルコール 19.4 g (107 mmol) をアセトン 350 ml に溶解し、氷冷下 2.5 規定のジョーンズ試薬 (John's Reagent) 94.5 ml (236 mmol) を加え、室温にて 5 時間攪拌した。反応混合物を酢酸エチルにて抽出し、酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄した後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて抽出した。水層を酢酸エチルにて洗浄し、濃塩酸にて酸性とした後、再び、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することにより、2-(2-ニトロ-6-メチルフェニル)酢酸 14.9 gを得た。

引き続き、2-(2-ニトロ-6-メチルフェニル)酢酸 10 g (51.3 mmol) をメタノール 100 ml に溶解し、濃硫酸 2 ml を加えた後、還流下 1.5 時間攪拌した。メタノールを留去した後、冰水 100 ml を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥した。ろ過後、溶媒を留去することにより、2-(2-ニトロ-6-メチルフェニル)酢酸メチル 10.8 gを得た。

引き続き得られた 2-(2-ニトロ-6-メトキシフェニル)酢酸メチル 10

. 8 g (52 mmol) をメタノール 50 ml に溶解し、これに 5% パラジウム－活性炭 0.2 g を加えた。水素雰囲気下室温にて 4 時間攪拌後、パラジウム－活性炭をろ別した。得られたろ液を減圧下溶媒を留去し、残渣を酢酸エチルに溶解し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより 2-(2-アミノ-6-メチルフェニル) 酢酸メチル 9.2 g を得た。

2-(2-アミノ-6-メチルフェニル) 酢酸メチル 9.2 g (51 mmol) を酢酸エチル 100 ml に溶解し、氷冷下、チオホスゲン 4.34 ml (57 mmol) を加えた後、70～80°C にて 2 時間攪拌した。次いで、反応混合物を氷冷し、さらに、50% ジメチルアミン水溶液 23 g (256 mmol) を加えた。反応混合物を室温まで昇温し、さらに 3 時間攪拌した後、水および濃塩酸を加え酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、ろ過後、減圧下溶媒を留去した。析出した結晶をろ別し、ろ液を濃縮後得られた残渣を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 2) にて精製することにより、メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-6-メチルフェニル) 酢酸 4.8 g を無色結晶として得た。

融点 : 121-123°C

また、原料として、3,4-ジメチルニトロベンゼンの代わりに、相当する 2-メチルニトロベンゼンを用いることにより、以下の化合物も同様に合成した。

メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-6-メトキシフェニル) 酢酸

融点 : 119-120°C

〔参考例 11〕

2-ブロモ-1-(2-フルオロー-4-トリフルオロメチルフェニル)-1-プロパンの合成

市販の 1-(2-フルオロー-4-トリフルオロメチルフェニル)-1-プロパン 11.05 g (50.2 mmol) をクロロホルム 110 ml に溶解し、次いで、臭素 8.03 g (50.2 mmol) を加え室温にて、1 時間攪拌した。反応混合物を氷水および飽和炭酸水素ナトリウム水溶液の混合物に注ぎ、クロロ

ホルム層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することにより、2-プロモ-1-(2-フルオロ-4-トリフルオロメチルフェニル)-1-プロパノン14.89gを得た。

¹H NMR (CDCl₃, δ (ppm)) : 1.91 (d, J=5.5Hz, 3H), 5.26 (q, J=5.5Hz, 1H), 7.3-7.95 (m, 3H)

[参考例12]

2-プロモ-1-(3, 4, 5-トリフルオロフェニル)-1-プロパノンの合成

市販の3, 4, 5-トリフルオロベンゾイルクロリド5.34g (27.45mmol) をジクロロメタン20mlに溶解し冰冷した。次いで、N-メチル-O-メチルヒドロキシルアミン塩酸塩3.21g (32.94mmol) およびトリエチルアミン6.67g (65.88mmol) を加え室温にて、18時間攪拌した。反応混合物に、水を加えクロロホルムにて抽出した。クロロホルム層を1規定塩酸および飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより3, 4, 5-トリフルオロベンゾイル-N-メトキシ-N-メチルアミド5.74gを得た。引き続き得られた、3, 4, 5-トリフルオロベンゾイル-N-メトキシ-N-メチルアミド2.5g (11.41mmol) をテトラヒドロフラン40mlに溶解し、-78°Cにて、0.89Mエチルマグネシウムプロミド15.4ml (13.69mmol) を加えた。反応混合物を室温まで昇温し、22時間攪拌した後、1N塩酸水溶液50mlに注いだ。酢酸エチルにて抽出し飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、ろ過後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(クロロホルム)にて精製することにより、1-(3, 4, 5-トリフルオロフェニル)-1-プロパノン1.25gを得た。

続いて得られた1-(3, 4, 5-トリフルオロフェニル)-1-プロパノン1.25g (6.64mmol) を1, 2-ジクロロエタン30mlに溶解し、次いで、臭素1.06g (13.29mmol) を加え室温にて3時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、1, 2-ジクロロエタン

層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することにより、2-ブロモ-1-(3, 4, 5-トリフルオロフェニル)-1-プロパン-1. 72 gを得た。

〔参考例13〕

2-ブロモ-1-(4-クロロフェニル)-2-メチルメルカプト-1-エタノンの合成

市販の2-ブロモ-1-(4-クロロフェニル)-1-エタノン1 g (4. 28 mmol) をN, N-ジメチルホルムアミド10 mlに溶解し、次いで、メチルメルカプタンナトリウム0. 33 g (4. 71 mmol) を加え室温にて、6時間攪拌した。反応混合物に水50 mlを加え、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をクロロホルム15 mlに溶解し、次いで、臭素0. 64 g (7. 97 mmol) を加え室温にて4. 5時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、クロロホルム層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することにより、2-ブロモ-1-(4-クロロフェニル)-2-メチルメルカプト-1-エタノン1. 1 gを得た。

〔参考例14〕

2-ブロモ-1-(1-メチル-5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-プロパン-1-オンの合成

1, 1, 1-トリフルオロ-2, 4-ペンタノン50. 7 g (0. 33 mol) をエタノール300 mlに溶解し、-30℃に冷却した。次いで、ヒドラジン1水和物16. 5 g (0. 33 mol) をエタノール50 mlに溶解したものゆっくりと加えた後、還流下2時間攪拌した。次いで、減圧下溶媒を留去し、トルエン300 mlを加えた。さらに、還流下5時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去することにより、5-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール49 gを得た。次いで、得られた5-メチル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール49 g (0. 33 mol) に水600 mlおよび過マンガン酸カリウム56. 7 g (0. 33 mol) を加え、80℃にて1時間攪拌した。さらに水1

0.0ml および過マンガン酸カリウム 56.7g (0.33mol) を加え、90°Cにて3時間攪拌した後、エタノール 10ml を加えさらに5分間攪拌した。反応混合物を熱時ろ過により、不溶物をろ別し、減圧下溶媒を約3分の1になるまで留去した。得られた残渣に濃塩酸を加え酸性にした後、酢酸エチルにて抽出後、酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後減圧下溶媒を留去することにより、5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 4.0gを得た。得られた 5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 2.0g (0.11mol) をエタノール 250ml に溶解し、次いで、濃硫酸 25ml を加えた後、還流下 4 時間攪拌した。減圧下溶媒を留去し、残渣を酢酸エチルに溶解した後、水および飽和食塩水にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、ろ過し、減圧下溶媒を留去することにより、5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸エチル 23.7g を得た。

引き続き、水素化ナトリウム 0.595g (13.6mmol) をテトラヒドロフラン 25ml に懸濁し、氷冷下、5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸エチル 2.58g (12.4mmol) を加え、室温にて1時間攪拌した。反応混合物にヨウ化メチル 1.94g (13.6mmol) を加え、室温にて12時間攪拌後、水素化ナトリウム 0.3g およびヨウ化メチル 2g を加え、さらに2時間攪拌した。さらに、還流下 2 時間攪拌し、冰水に注いだ後、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をメタノール 10ml に溶解し、水および水酸化ナトリウム 0.744g (18.6mmol) を加え室温にて12時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去した。水および濃塩酸を加え酸性とした後、析出した結晶をろ取することにより、5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-カルボン酸 2gを得た。引き続き得られた 5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-カルボン酸 2g (10.3mmol) をベンゼン 10ml に溶解し、次いで、塩化チオニル 2.45g (20.6mmol) および N,N-ジメチルホルムアミド 1滴を加え、還流下 2.5 時間攪拌した。減圧下溶媒を留去し、得られた残渣にジクロロメタン 20ml を

加え氷冷した。次いで、N-メチル-O-メチルヒドロキシルアミン塩酸塩 1.51 g (15.5 mmol) およびトリエチルアミン 4.17 g (40.3 mmol) を加え室温にて、12時間攪拌した。反応混合物に、水を加えクロロホルムにて抽出した。クロロホルム層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-カルボン酸-N-メトキシ-N-メチルアミド 2.4 gを得た。引き続き得られた、5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-カルボン酸-N-メトキシ-N-メチルアミド 2.37 g (10 mmol) をテトラヒドロフラン 20 ml に溶解し、-78°Cにて、0.89 M エチルマグネシウムプロミド 13.5 ml (12 mmol) を加えた。反応混合物を室温まで昇温し、3時間攪拌した後、さらに 0.89 M エチルマグネシウムプロミド 13.5 ml (12 mmol) を加えた。引き続き室温にて12時間攪拌し、1.5 N 塩酸水溶液 120 ml に注いだ。酢酸エチルにて抽出し飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、ろ過後、減圧下溶媒を留去することにより、1-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-1-プロパン 2 gを得た。

継いて得られた 1-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-1-プロパン 1 g (4.9 mmol) をクロロホルム 5 ml に溶解し、次いで、臭素 0.543 g (3.4 mmol) および 48% 臭化水素酸水溶液 1 滴を加え室温にて 12 時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、クロロホルムにて抽出した。クロロホルム層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することにより、2-ブロモ-1-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-1-プロパン 1.16 gを得た。

[参考例 15]

2-ブロモ-1-(5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-イル)-1-プロパン-1-オンの合成

参考例 14 で得られた 5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸 10 g (0.556 mol) をベンゼン 80 ml に溶解し、次いで、塩化

チオニル 10 g (85 mmol) および N, N-ジメチルホルムアミド 1 滴を加え、還流下 4 時間攪拌した。減圧下溶媒を留去し、得られた残渣にジクロロメタンを加え氷冷した。次いで、N-メチル-O-メチルヒドロキシルアミン塩酸塩 5.5 g (56.4 mmol) およびトリエチルアミン 15 g を加え室温にて、2 時間攪拌した。反応混合物に、水および濃塩酸を加えクロロホルムにて抽出した。クロロホルム層を飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより 5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸-N-メトキシ-N-メチルアミド 11 g を得た。引き続き得られた、5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-カルボン酸-N-メトキシ-N-メチルアミド 11 g をテトラヒドロフラン 200 ml に溶解し、-70 °C にて、0.89 M エチルマグネシウムプロミド 116.3 ml (148 mmol) を加えた。反応混合物を室温まで昇温し、3 時間攪拌した後、希塩酸水溶液に注いだ。酢酸エチルにて抽出し飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、ろ過後、減圧下溶媒を留去することにより、1-(5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-イル)-1-プロパノン 11 g を得た。

続いて得られた 1-(5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-イル)-1-プロパノン 6.71 g (34.95 mmol) をクロロホルム 70 ml に溶解し、次いで、臭素 6.2 g (38.75 mmol) および 4.8% 臭化水素酸水溶液 5 滴を加え 35 °C にて 2 時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、クロロホルムにて抽出した。クロロホルム層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することにより、2-プロモ-1-(5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-3-イル)-1-プロパノン 10 g を得た。

[参考例 16]

2-プロモ-1-(1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-5-イル)-1-プロパン-1-オンの合成

1, 1, 1-トリフルオロ-2, 4-ペンタノン 10 g (64.9 mmol) をエタノール 40 ml に溶解し、-30 °C に冷却した。次いで、メチルヒドラジン 2.99 g (64.9 mmol) を水 5.5 ml に溶解したものをゆっくりと

加えた後、還流下4時間攪拌した。次いで、減圧下溶媒を留去し、水を加え酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより、1、5-ジメチル-3-トリフルオロメチルピラゾール7gを得た。次いで、得られた1、5-ジメチル-3-トリフルオロメチルピラゾール7g(42.7mmol)に水200mlおよび過マンガン酸カリウム7.08g(44.8mmol)を加え、100℃にて1.5時間攪拌した。さらに水50mlおよび過マンガン酸カリウム7.08g(44.8mmol)を加え、100℃にて2時間攪拌した後、エタノール5mlを加えさらに10分間攪拌した。反応混合物を熱時ろ過により、不溶物をろ別し、得られたろ液に濃塩酸を加え酸性にした後、析出した結晶をろ取することにより、1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-5-カルボン酸3.39gを得た。得られた1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-5-カルボン酸3.39g(17.5mmol)をベンゼン10mlに溶解し、次いで、塩化チオニル4.16g(35mmol)およびN,N-ジメチルホルムアミド1滴を加え、還流下3時間攪拌した。減圧下溶媒を留去し、得られた残渣にジクロロメタン50mlを加え氷冷した。次いで、N-メチル-O-メチルヒドロキシルアミン塩酸塩2.57g(26.3mmol)およびトリエチルアミン7.07g(70mmol)を加え室温にて、2時間攪拌した。反応混合物に、水を加えクロロホルムにて抽出した。クロロホルム層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-5-カルボン酸-N-メトキシ-N-メチルアミド3.96gを得た。引き続き得られた、1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-5-カルボン酸-N-メトキシ-N-メチルアミド3.96g(16.7mmol)をテトラヒドロフラン40mlに溶解し、-78℃にて、0.89Mエチルマグネシウムプロミド22.5ml(20mmol)を加えた。反応混合物を室温まで昇温し、24時間攪拌した後、1.5N塩酸水溶液に注いだ。酢酸エチルにて抽出し飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、ろ過後、減圧下溶媒を留去することにより、1-(1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-5-イル)-1-プロパノン3.9gを得た。

続いて得られた 1-(1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-5-イル)-1-プロパン 0.8 g (3.88 mmol) をクロロホルム 6 ml に溶解し、次いで、臭素 0.621 g (3.88 mmol) および 48% 臭化水素酸水溶液 1 滴を加え室温にて 12 時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、クロロホルムにて抽出した。クロロホルム層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することにより、2-プロモ-1-(1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-5-イル)-1-プロパン 0.84 g を得た。

[参考例 17]

2-プロモ-1-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-1-プロパンの合成

窒素雰囲気下、2-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン 7.86 g (43.3 mmol)、青酸亜鉛 10.16 g (86.5 mmol) およびテトラキストリフェニルホスフィンパラジウム (0) 5 g (4.33 mmol) を N, N-ジメチルホルムアミド 80 ml に懸濁し、90°C にて 3 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、アンモニア水および冰水の混合物に注いだ後、ジエチルエーテルにて抽出した。ジエチルエーテル層を水および飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することにより、2-シアノ-5-トリフルオロメチルピリジン 1.1 g (純度約 60%) を得た。得られた 2-シアノ-5-トリフルオロメチルピリジン 6 g (23.6 mmol) をテトラヒドロフラン 30 ml に溶解し、-78°C にて 0.89 M エチルマグネシウムブロミド 5.3 ml (47.2 mmol) を加えた。反応混合物を室温まで昇温し、2 時間攪拌した後、2 N 塩酸水溶液に注いだ。酢酸エチルにて抽出し飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、ろ過後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン : 酢酸エチル = 20 : 1) にて精製することにより、することにより、1-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-1-プロパン 2.7 g を得た。引き続き得られた 1-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-1-プロパン 2.6 g (12.9 mmol) をクロロホルムに溶解し、臭素 2.06 g (12

. 9 mmol) を加え室温にて 16 時間攪拌した。次いで、還流下 1 時間攪拌し、室温まで冷却後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、クロロホルムにて抽出した。クロロホルム層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することにより、2-ブロモ-1-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-1-プロパン 3.5 gを得た。

[参考例 18]

2-ブロモ-1-(6-トリフルオロメチルピリジン-3-イル)-1-プロパンの合成

エチルビニルエーテル 10 g (139 mmol)、ジクロロメタン 100 ml およびピリジン 13.2 g (167 mmol) の混合物を氷冷し、次いで、トリフルオロ酢酸無水物 32 g (153 mmol) を加え、室温にて、4 時間攪拌した。反応混合物を水 100 ml にて洗浄し、1 規定塩酸、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することにより、4-エトキシ-1,1,1-トリフルオロ-3-ブテン-2-オン 23.5 gを得た。

続いて得られた、4-エトキシ-1,1,1-トリフルオロ-3-ブテン-2-オン 10 g (59.5 mmol)、3-ジメチルアミノアクリロニトリル 5.72 g (59.5 mmol) およびトルエン 10 ml の混合物を 100 °C にて 4 時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、n-ヘキサン 30 ml を加えた。析出した結晶をろ取した。得られた結晶を N,N-ジメチルホルムアミド 30 ml に溶解し、酢酸アンモニウム 3.4 g (89.3 mmol) を加え、室温にて 16 時間攪拌した。反応混合物に水を加え、ジエチルエーテルにて抽出した。ジエチルエーテル層を、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、水および法食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより、2-トリフルオロメチル-5-シアノピリジン 4.1 gを得た。

2-トリフルオロメチル-5-シアノピリジン 8.36 g (48.6 mmol) をエタノール 50 ml に溶解し、水 5 ml および水酸化ナトリウム 2.33 g (58.3 mmol) を加え還流下 5 時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去した。水および濃塩酸を加え酸性とした後、析出した結晶をろ取した。得られた結晶を

ベンゼン 100 ml に溶解し、次いで、塩化チオニル 10.42 g (87.6 mmol) および N, N-ジメチルホルムアミド 2 滴を加え、還流下 2 時間攪拌した。減圧下溶媒を留去し、得られた残渣にジクロロメタン 120 ml を加え氷冷した。次いで、N-メチル-O-メチルヒドロキシリアルアミン塩酸塩 6.4 g (65.7 mmol) およびトリエチルアミン 13.3 g (131.4 mmol) を加え室温にて、16 時間攪拌した。反応混合物に水を加えクロロホルムにて抽出した。クロロホルム層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をテトラヒドロフラン 25 ml に溶解し、-78 °C にて、0.89 M エチルマグネシウムプロミド 17.3 ml (15.4 mmol) を加えた。反応混合物を室温まで昇温し、3 時間攪拌した後、1.5 N 塩酸水溶液 120 ml に注いだ。酢酸エチルにて抽出し飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、ろ過後、減圧下溶媒を留去することにより、1-(2-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-1-プロパノン 2 g を得た。

続いて得られた 1-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-1-プロパノン 1 g (4.9 mmol) をクロロホルム 5 ml に溶解し、次いで、臭素 0.543 g (3.4 mmol) および 4.8% 臭化水素酸水溶液 1 滴を加え室温にて 12 時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、クロロホルムにて抽出した。クロロホルム層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することにより、1-(6-トリフルオロメチルピリジン-3-イル)-1-プロパノン 2 g を得た。得られた 1-(6-トリフルオロメチルピリジン-3-イル)-1-プロパノン 1 g (4.93 mmol) をクロロホルム 10 ml に溶解し、臭素 0.787 g (4.93 mmol) および、4.8% 臭化水素酸 3 滴を加え還流か 30 分間攪拌した。室温まで冷却後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、クロロホルムにて抽出した。クロロホルム層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去することにより、2-ブロモ-1-(6-トリフルオロメチルピリジン-3-イル)-1-プロパノン 1.39 g を得た。

〔参考例 19〕

2-ブロモ-1-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-1-エタノンの合成

窒素雰囲気下、2-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン15g(82.6mmol)、青酸亜鉛19.4g(165.2mmol)およびテトラキストリフェニルホスフィンパラジウム(0)9.55g(8.26mmol)をN,N-ジメチルホルムアミド150mlに懸濁し、80°Cにて4.5時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、アンモニア水50mlおよび氷水250mlの混合物に注いだ後、ジエチルエーテルにて抽出した。ジエチルエーテル層を水および飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をエタノール80mlに溶解し、水酸化ナトリウム3.97g(99.1mmol)を水8mlに溶解した溶液を加えた。還流下2.5時間攪拌し、さらに水酸化ナトリウム1g、エタノール30mlおよび水3mlを加え2.5時間攪拌した。反応混合物から減圧下溶媒を留去し、得られた残渣に水50mlを加えた後、ジエチルエーテルにて洗浄後、濃塩酸を加え、pH2に調整した。析出した結晶をろ取することにより、5-トリフルオロメチルピコリン酸9.1gを得た。引き続き得られた5-トリフルオロメチルピコリン酸8.63g(45.2mmol)をベンゼン50mlに溶解し、次いで、塩化チオニル8.06g(67.8mmol)を加え、還流下2時間攪拌した。反応混合物から、減圧下溶媒を留去することにより、5-トリフルオロメチルピコリン酸クロライド8.62gを得た。

引き続き、冰冷下、塩化マグネシウム0.74g(7.73mmol)、マロン酸ジメチル1.02g(7.73mmol)、トリエチルアミン1.56g(15.47mmol)およびアセトニトリル10mlの混合物に5-トリフルオロメチルピコリン酸クロライド1.5g(7.16mmol)を加え、室温にて1時間攪拌後、水100mlに注いだ。濃塩酸を加え、pH3に調整した後、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を、水および飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジメチルスルホキシド10mlに溶解し、水0.28gを加え、140°Cにて1時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、水100mlに注ぎ、酢酸エチルにて抽

出した。酢酸エチル層を水および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。引き続き得られた残渣をクロロホルム 10 ml に溶解し、臭素 1.02 g (6.35 mmol) を加え、還流下 2 時間攪拌した。反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および冰水の混合液に注ぎ、クロロホルムにて抽出後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。減圧下溶媒を留去することにより、2-ブロモ-1-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-1-エタノン 1.7 g を得た。

[参考例 20]

2-(2-メトキシカルボニルメチルフェニルイミノ)-[1,3]オキサチオール-4-メチル-5-カルボン酸の合成

メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸 2 g (7.94 mmol) を 1,4-ジオキサン 100 ml に溶解し、これに 2-オキソ-3-ブロモブタン酸 1.58 g (8.73 mmol) を加えた後、0.5 時間加熱還流した。減圧下 1,4-ジオキサンを留去した後、反応混合物に水を加え酢酸エチルにて抽出した。続いて有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて抽出した。得られた水層に 1 N 塩酸を加えて酸性にした後、酢酸エチルにて抽出した。有機層を無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、ろ過し、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣をジエチルエーテルにて洗浄することにより目的の 2-(2-メトキシカルボニルメチルフェニルイミノ)-[1,3]オキサチオール-4-メチル-5-カルボン酸 1.8 g を茶褐色油状物として得た。

[参考例 21]

N-メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-6-メチルフェニル)酢酸アミドの合成

参考例 10 にて得られたメチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-6-メチルフェニル)酢酸 1.33 g (5 mmol) をメタノール 10 ml に溶解し、次いでメチルアミンの 40% メタノール溶液 3.9 g (5.0 mmol) を加え、室温にて 16 時間攪拌した。減圧下反応溶液を留去し、析出した結晶をジエチルエーテルにて洗浄する事により、目的の N-メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-6-メチルフェ

ニル) 酢酸アミド 1. 25 g を無色結晶として得た。

融点 : ℃

同様に、参考例 5 にて得られたメチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸を原料として用いて、N-メチル 2-(2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)フェニル)酢酸アミドを得た。

融点 : 149 - 151℃

[参考例 22]

(4-(2, 6-ジフルオロフェニル)-5-メチル-[1, 3]ジチオール-2-イリデン)-ジメチルアンモニウム 硫酸塩の合成

ジメチルジチオカルバミン酸ナトリウム 2 水和物 7. 93 g (44. 33 mmol) をアセトニトリル 80 ml に懸濁し、これに 2-プロモ-1-(2, 6-ジフルオロフェニル)-プロパン-1-オン 10. 03 g (40. 3 mmol) を加え、室温にて 1 時間攪拌した。減圧下溶媒を留去し、水 100 ml を加え、酢酸エチルにて抽出した。有機層を水および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。引き続き、残渣に濃硫酸 13 ml を加え室温にて 1 時間攪拌した。反応混合物に酢酸エチル 1. 5 l を注ぎ、析出した結晶をろ取することにより、(4-(2, 6-ジフルオロフェニル)-5-メチル-[1, 3]ジチオール-2-イリデン)-ジメチルアンモニウム 硫酸塩 10 g を無色結晶として得た。

[参考例 23]

4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1, 3-ジチオール-2-イリデンジメチルアンモニウム 硫酸塩の合成

50%ジメチルアミン水溶液 1. 35 g (15 mmol) をテトラヒドロフラン 10 ml に溶解し、次いで二硫化炭素 0. 57 g (7. 5 mmol) を加え室温にて 1 時間攪拌した。さらに 2-プロモ-1-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1-エタノン 2 g (7. 49 mmol) を加え引き続き 16 時間攪拌した後、減圧下溶媒を留去し、析出した結晶を水洗後、酢酸エチルに溶解した。酢酸エチル溶液を食塩水にて洗浄後、無水硫酸ナトリウムにて乾燥し、減圧下溶

媒を留去した。得られた残渣に、0℃にて濃硫酸4mlを加え10分間攪拌した後、酢酸エチルを注いだ。析出した結晶をろ取することにより、目的の4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,3-ジチオール-2-イリデンジメチルアンモニウム 硫酸塩1.1gを無色結晶として得た。

[参考例24]

(4-(4-メチルフェニル)-5-メチル-[1,3]オキサチオール-2-イリデン)-ジメチルアンモニウム 臭化水素酸塩の合成

テトラメチルチオウレア13.2g(0.1mol)をジオキサン300mlに溶解し、次いで2-プロモ-1-(4-メチルフェニル)-プロパン-1-オン22.7g(0.1mol)を加え、還流下10時間攪拌した。反応混合物を室温まで冷却し、析出した結晶をろ取することにより、目的の(4-(4-メチルフェニル)-5-メチル-[1,3]オキサチオール-2-イリデン)-ジメチルアンモニウム 臭化水素酸塩21gを無色結晶として得た。

同様に、2-プロモ-1-(4-トリフルオロメチルフェニル)-プロパン-1-オンを原料として用いることで、(4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-5-メチル-[1,3]オキサチオール-2-イリデン)-ジメチルアンモニウム 臭化水素酸塩を無色結晶として得た。

[参考例25]

2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)ニトロベンゼンの合成

2-ニトロアニリン10g(72.4mmol)を酢酸エチル150mlに溶解し、氷浴にて冷却した。これに、チオホスゲン6.62ml(86.9mmol)を加え、還流下4時間攪拌した。反応混合物を氷浴にて冷却し、50%ジメチルアミン水溶液65.2g(724mmol)を内温が7~13℃になるように加え、さらに室温にて16時間攪拌した。反応混合物に水10mlを加えた後、氷浴にて冷却しながら濃塩酸を加え酸性とし、次いで、酢酸エチルにて抽出した。酢酸エチル層を食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。析出した結晶をジイソプロピルエーテルにて洗浄する事により、目的の2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)ニトロベンゼン14gを無色結晶として得た。

融点：95—97℃

同様に、原料として2-ヨードアニリンを用いることで、2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)ヨードベンゼンを得た。

融点：153—154℃

〔参考例26〕

メチル (メトキシメチル (2-((ジメチルアミノ)チオキソメチル)アミノ)-6-メチルフェニル)カルバミン酸の合成

トリホスゲン2.93g (9.4mmol) をトルエン10mlに溶解し、氷浴にて冷却した。これに2-メチル-6-ニトロアニリン3g (19.7mmol) のトルエン15ml溶液を加え4時間加熱還流した。常圧にて、トルエンを留去し得られた残渣にメタノール20mlを加えた。次いでピリジン3滴およびトリエチルアミン2mlを加え、3時間加熱還流した。反応混合物に酢酸エチルを加え、不溶物をろ別した後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣に酢酸エチルを加え、水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより、メチル 6-メチルフェニルカルバミン酸2.67gを得た。引き続き得られたメチル 6-メチルフェニルカルバミン酸2.67g (12.7mmol) をテトラヒドロフラン44mlに溶解し、水酸化カリウム1.68g (25.4mmol) 、トリエチルベンジルアンモニウムクロリド0.29g (1.3mmol) およびクロロメチルメチルエーテル1.74g (21.6mol) を加え室温にて30分間攪拌した。次いで水酸化カリウムおよびクロロメチルメチルエーテルそれぞれ0.7gを加えさらに30分攪拌した。不溶物をろ別し、ろ液に酢酸エチルおよび水を加え、分液した。酢酸エチル層を食塩水にて洗浄し、無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去することにより、メチル メトキシメチル (6-メチルフェニル)カルバミン酸3.2gを得た。引き続き得られたメチル メトキシメチル (6-メチルフェニル)カルバミン酸1.5gを酢酸エチル15mlに溶解し、これに5%パラジウム-活性炭0.15gを加えた。水素雰囲気下室温にて2時間攪拌後、パラジウム-活性炭をろ別した。得られたろ液を無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、ろ過により不溶物をろ別した。ろ液にトリエチルアミン1.79g (17.7mmol) を加え、次

いで氷冷下、チオホスゲン 0.54 ml (7.1 mmol) を加えた後、室温にて 30 分間攪拌した。次いで、反応混合物を氷冷し、さらに、50%ジメチルアミン水溶液 1.06 g (11.8 mmol) を加えた。反応混合物を室温まで昇温し、さらに 30 分間攪拌した後、水および飽和塩化アンモニウム水溶液を加えた。酢酸エチル層を飽和食塩水にて洗浄後、無水硫酸マグネシウムにて乾燥し、ろ過後、減圧下溶媒を留去した。得られた残渣を、ジイソプロピルエーテルにて洗浄することにより、目的のメチル ((メトキシメチル) 2-((ジメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ) - 6-メチルフェニル) カルバミン酸 1.68 g を無色結晶として得た。

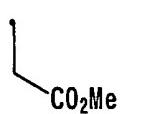
〔参考例 27〕

2-((アザ (3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル) -4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン) メチル) ヨードベンゼンの合成

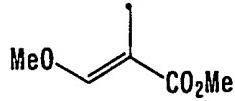
2-((ジメチルアミノ) チオキソメチル) アミノ) ヨードベンゼン 1.2 g (3.9 mmol) を 20 ml の N,N-ジメチルホルムアミドに溶解し、これに 2-ブロモ-1-(3-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル)-1-ブロパン 1.12 g (3.9 mmol) を加えた。60°Cにて 2 時間攪拌を行った後、さらに 90°Cにて 2 時間攪拌を行った。反応混合物を酢酸エチルに溶解し、水および食塩水にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥後、減圧下溶媒を留去した。得られた反応混合物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル:ヘキサン = 1:2) にて精製することにより目的の 2-ラフィー (アザ (3-(5-トリフルオロメチル-1-メチルピラゾール-3-イル) -4-メチル-2,5-オキサチオレニリデン) メチル) ヨードベンゼン 1.8 g を無色油状物として得た。

屈折率; $n_{D21} = 1.5934$

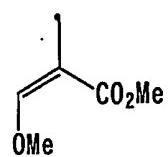
次にこれらの方々に準じて製造した一般式 (1) の化合物の物性値等を第 8 表から第 20 表に示す。なお、表中の略号は前述の通りであり、T1 から T33 および H-ell から H-ell48 は以下のものを表す。



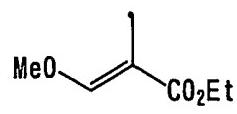
T1:



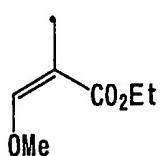
T2-1:



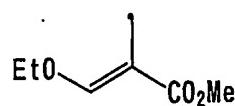
T2-2:



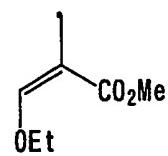
T3-1:



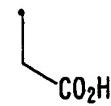
T3-2:



T4-1:



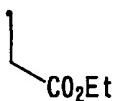
T4-2:



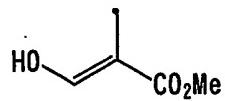
T5:



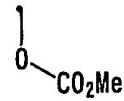
T6:



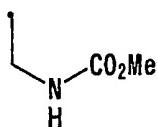
T7:



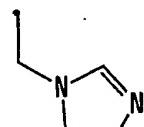
T8:



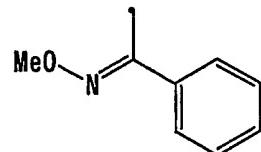
T9:



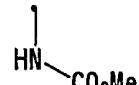
T10:



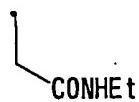
T11:



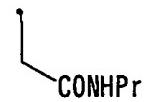
T12:



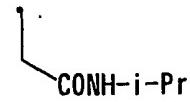
T13:



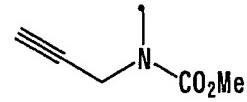
T14:



T15:



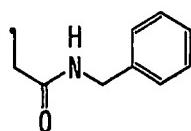
T16:



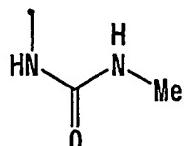
T17:



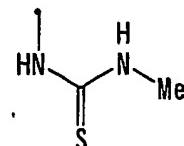
T18:



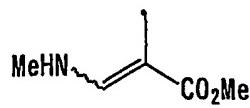
T19:



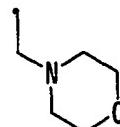
T20:



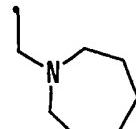
T21:



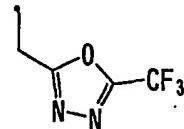
T22:



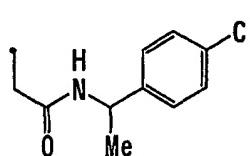
T23:



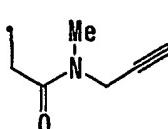
T24:



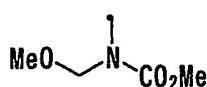
T25:



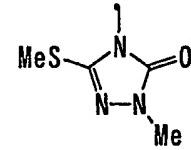
T26:



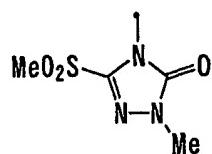
T27:



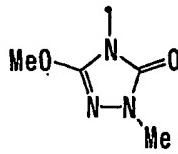
T28:



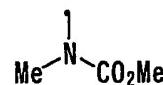
T29:



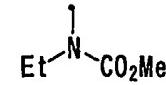
T30:



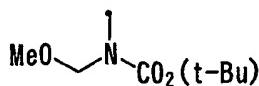
T31:



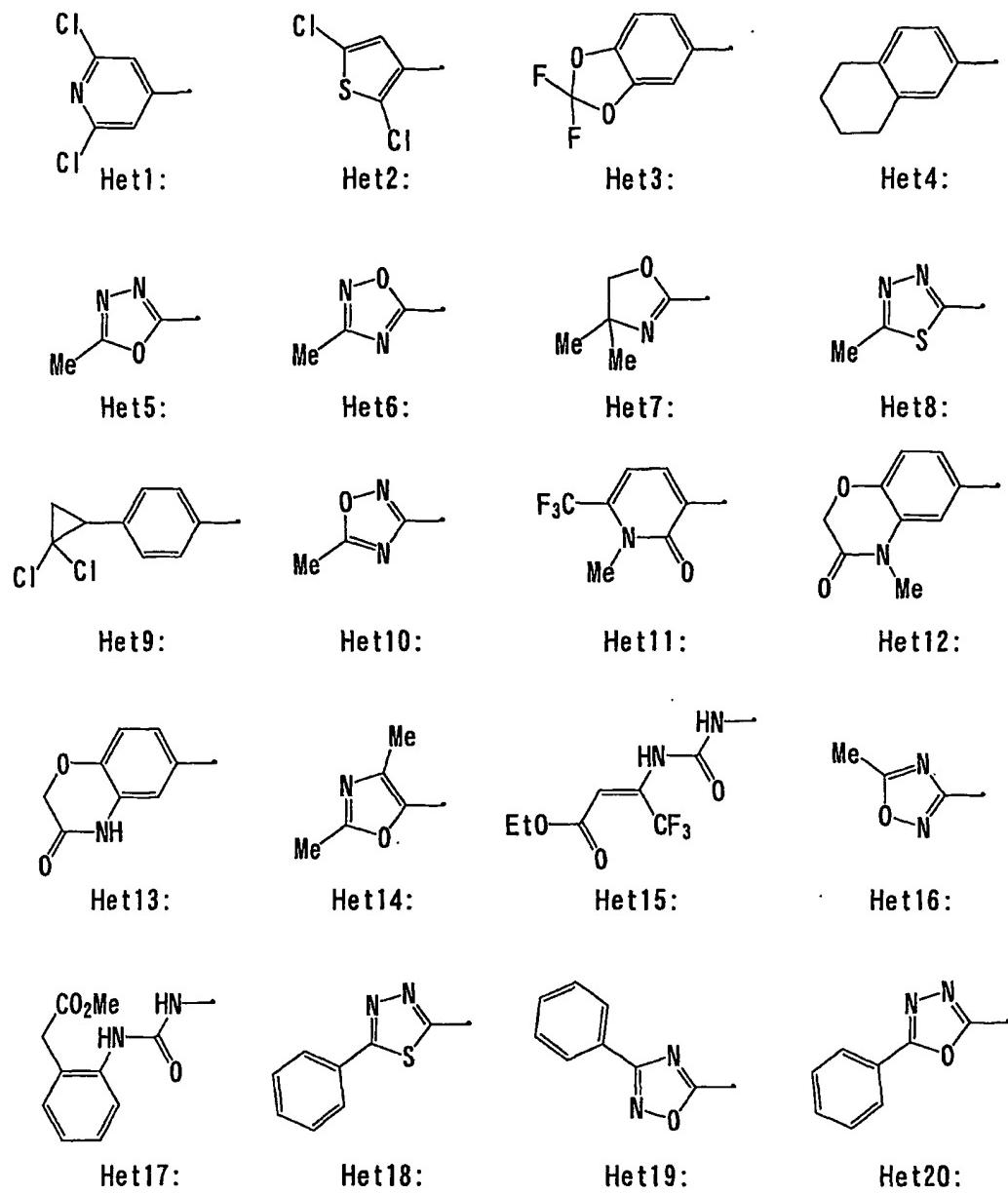
T32:

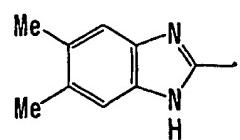


T33:

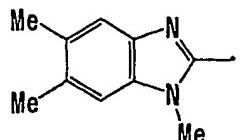


T34:

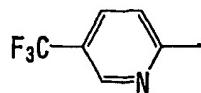




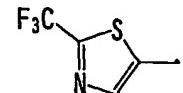
Het21:



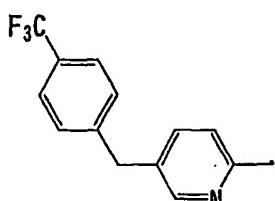
Het22:



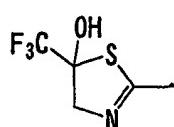
Het23:



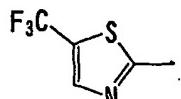
Het24:



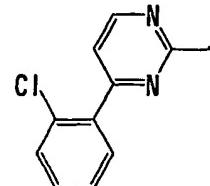
Het25:



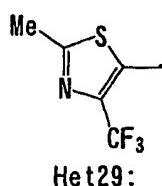
Het26:



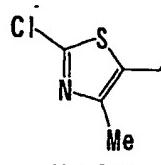
Het27:



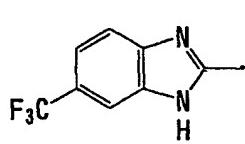
Het28:



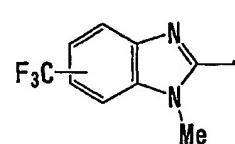
Het29:



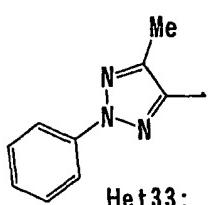
Het30:



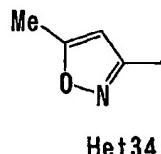
Het31:



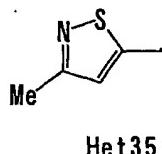
Het32:



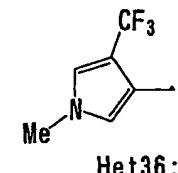
Het33:



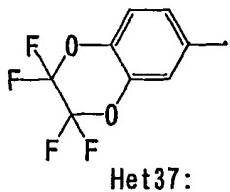
Het34:



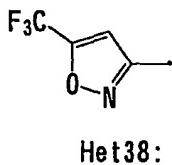
Het35:



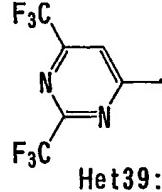
Het36:



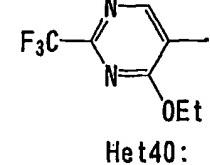
Het37:



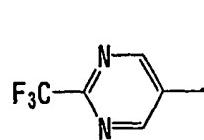
Het38:



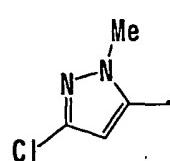
Het39:



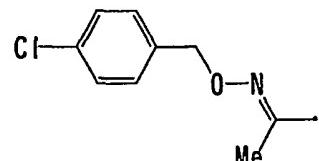
Het40:



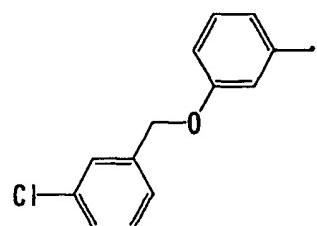
Het41:



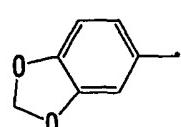
Het42:



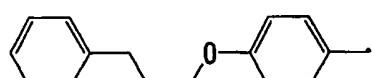
Het43:



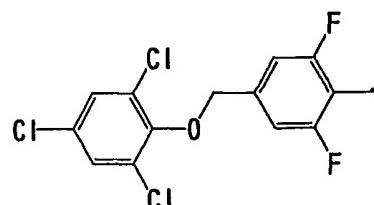
Het44:



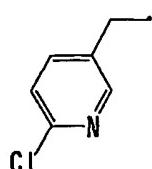
Het45:



Het46:

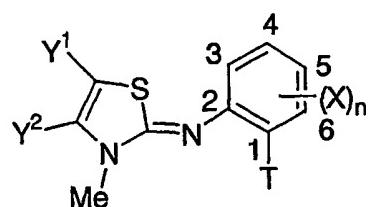


Het47:



Het48:

〔第8表〕



N o.	Y ¹	Y ²	T	X	物性(m.p.等)	備考
I-1	H	Ph	T1	H	n_{D21} .51.5600	
I-2	H	2-Cl-Ph	T1	H	m.p.112-113°C	
I-3	H	3-Cl-Ph	T1	H	n_{D22} .11.4906	
I-4	H	4-Cl-Ph	T1	H	m.p.73-74°C	
I-5	H	2-MeO-Ph	T1	H	m.p.86-89°C	
I-6	H	3-MeO-Ph	T1	H	n_{D21} .31.4859	
I-7	H	4-MeO-Ph	T1	H	m.p.82-83°C	
I-8	H	2-Me-Ph	T1	H	m.p.110-112°C	

I-9	H	3-Me-Ph	T1	H	$\eta_{D21.6}$ 1.5391
I-10	H	4-Me-Ph	T1	H	$\eta_{D21.2}$ 1.5282
I-11	H	2-F-Ph	T1	H	m.p. 102.5-104.5°C
I-12	H	3-F-Ph	T1	H	$\eta_{D21.6}$ 1.5762
I-13	H	4-F-Ph	T1	H	m.p. 75-76°C
I-14	H	4-NO ₂ -Ph	T1	H	m.p. 125-127°C
I-15	H	4-Ph-Ph	T1	H	$\eta_{D22.1}$ 1.5154
I-16	H	4-CF ₃ -Ph	T1	H	$\eta_{D21.9}$ 1.5115
I-17	H	3-CN-Ph	T1	H	m.p. 137-141°C
I-18	H	2-Naphthyl	T1	H	m.p. 95-96°C
I-19	H	2-Thienyl	T1	H	$\eta_{D21.8}$ 1.4598
I-20	H	2-Furyl	T1	H	$\eta_{D21.8}$ 1.5382
I-21	H	3-Pyridyl	T1	H	m.p. 85-87°C
I-22	H	H	T1	H	$\eta_{D20.2}$ 1.5187
I-23	H	Me	T1	H	$\eta_{D20.2}$ 1.5172
I-24	H	MeOC(=O)	T1	H	$\eta_{D20.2}$ 1.5393
I-25	H	t-Bu	T1	H	$\eta_{D21.8}$ 1.4629
I-26	H	MeC(=NOMe)-	T1	H	m.p. 48-50°C
I-27	H	Et	T1	H	$\eta_{D21.6}$ 1.6100
I-28	H	i-Pr	T1	H	$\eta_{D21.0}$ 1.5982
I-29	H	CF ₃	T1	H	$\eta_{D21.7}$ 1.5528
I-30	H	ClCH ₂	T1	H	$\eta_{D21.8}$ 1.6074
I-31	H	MeSCH ₂	T1	H	$\eta_{D21.1}$ 1.6315
I-32	MeCO	Me	T1	H	$\eta_{D20.2}$ 1.5126
I-33	Me	Me	T1	H	$\eta_{D21.7}$ 1.6084
I-34	H	Ph	T5	H	m.p. 143-144°C
I-35	H	Ph	T6	H	m.p. 123-125°C
I-36	H	Ph	T7	H	$\eta_{D20.0}$ 1.4620
I-37	H	Ph	T2-1	H	m.p. 118-120°C
I-38	H	Ph	T2-2	H	m.p. 141-143°C
I-39	H	Ph	T3-1	H	$\eta_{D22.0}$ 1.4908
I-40	H	Ph	T3-2	H	$\eta_{D22.0}$ 1.5098
I-41	H	Ph	T4-1	H	$\eta_{D22.0}$ 1.5902
I-42	H	Ph	T4-2	H	$\eta_{D22.0}$ 1.5005
I-43	H	2-Cl-Ph	T2-1	H	m.p. 166-167°C
I-44	H	2-Cl-Ph	T2-2	H	m.p. 133-134°C
I-45	H	3-Cl-Ph	T2-1	H	m.p. 115-116°C
I-46	H	3-Cl-Ph	T2-2	H	m.p. 133-134°C
I-47	H	4-Cl-Ph	T2-1	H	m.p. 154-156°C
I-48	H	4-Cl-Ph	T2-2	H	m.p. 136-138°C
I-49	H	4-MeO-Ph	T2-1, 2 mixt.	H	m.p. 151-153°C
I-50	H	4-Me-Ph	T2-1	H	粘稠油状物
I-51	H	4-Me-Ph	T2-2	H	粘稠油状物
I-52	H	4-F-Ph	T2-1	H	粘稠油状物
I-53	H	4-F-Ph	T2-2	H	粘稠油状物
I-54	H	4-Ph-Ph	T2-1	H	m.p. 71-75°C
I-55	H	4-CF ₃ -Ph	T2-1	H	m.p. 169-171°C
I-56	H	4-CF ₃ -Ph	T2-2	H	m.p. 131-132°C
I-57	H	2-Naphthyl	T2-1	H	m.p. 136-138°C
I-58	H	2-Naphthyl	T2-2	H	油状物
I-59	H	2-Thienyl	T2-1	H	油状物
I-60	H	H	T2-1	H	m.p. 115-117°C
I-61	H	H	T2-2	H	m.p. 109-111°C
I-62	H	Me	T2-1	H	m.p. 122-123°C
I-63	H	Me	T2-2	H	m.p. 108-109°C
I-64	H	t-Bu	T2-1	H	m.p. 120-121°C
I-65	H	t-Bu	T2-2	H	m.p. 118-120°C
I-66	H	MeC(=NOMe)-	T2-1	H	$\eta_{D21.9}$ 1.4912

I-67	H	MeC(=NOMe)-	T2-2	H	n_{D22} .01.4876
I-68	H	Et	T2-1	H	m.p.78-80°C
I-69	H	Et	T2-2	H	n_{D21} .51.6154
I-70	H	i-Pr	T2-1	H	n_{D21} .71.5772
I-71	H	i-Pr	T2-2	H	m.p.104-106°C
I-72	H	CF ₃	T2-1	H	n_{D21} .31.5638
I-73	H	CF ₃	T2-2	H	n_{D21} .61.5507
I-74	Me	H	T2-1	H	m.p.100-101°C
I-75	Me	H	T2-2	H	m.p.125-127°C
I-76	Me	Me	T2-1	H	m.p.162-163°C
I-77	Me	Me	T2-2	H	m.p.148-152°C
I-78	H	2-Thiazolyl	T1	H	m.p.93-94°C
I-79	H	2,3-Cl ₂ -Ph	T1	H	粘稠油状物
I-80	H	3,5-Cl ₂ -Ph	T1	H	n_{D21} .31.4874
I-81	H	2,6-Cl ₂ -Ph	T1	H	m.p.126-128°C
I-82	H	2,5-Cl ₂ -Ph	T1	H	m.p.92-93.5°C
I-83	H	2,4-Cl ₂ -Ph	T1	H	m.p.116.5-117.5°C
I-84	H	3,4-Cl ₂ -Ph	T1	H	n_{D21} .21.5676
I-85	H	2,3-F ₂ -Ph	T1	H	m.p.60-61°C
I-86	H	3,4-F ₂ -Ph	T1	H	n_{D21} .61.5595
I-87	H	2,6-F ₂ -Ph	T1	H	m.p.137.5-138.5°C
I-88	H	2,5-F ₂ -Ph	T1	H	m.p.95-96°C
I-89	H	2,4-F ₂ -Ph	T1	H	m.p.96-98°C
I-90	H	2-Pyrazyl	T1	H	m.p.84-86°C
I-91	H	2-Benzofuranyl	T1	H	n_{D20} .61.5170
I-92	H	4-Br-Ph	T1	H	n_{D20} .120-122°C
I-93	H	4-Et-Ph	T1	H	n_{D20} .71.5065
I-94	H	4-PhO-Ph	T1	H	n_{D20} .71.4881
I-95	H	2-CF ₃ -Ph	T1	H	n_{D20} .61.5355
I-96	H	4-CF ₃ O-Ph	T1	H	n_{D21} .31.5178
I-97	H	2-F-6-CF ₃ -Ph	T1	H	m.p.99.5-101°C
I-98	H	Het43	T1	H	n_{D21} .41.5141
I-99	H	Het42	T1	H	m.p.89-91°C
I-100	Cl	Ph	T1	H	n_{D21} .51.5748
I-101	Ph	Ph	T1	H	m.p.116-118°C
I-102	Me	Ph	T1	H	m.p.89-91°C
I-103	Me ₂ NCH ₂	Ph	T1	H	n_{D21} .31.4743
I-104	H	2-Cl-Ph	T8	H	m.p.143-144°C
I-105	H	2-MeO-Ph	T2-1	H	m.p.130-131°C
I-106	H	2-MeO-Ph	T2-2	H	m.p.129-131.5°C
I-107	H	3-MeO-Ph	T2-1	H	m.p.127-130°C
I-108	H	3-MeO-Ph	T2-2	H	m.p.109-113°C
I-109	H	2-Me-Ph	T2-1	H	m.p.111-113°C
I-110	H	2-Me-Ph	T2-2	H	m.p.139.5-142°C
I-111	H	3-Me-Ph	T2-1	H	m.p.117.5-119°C
I-112	H	3-Me-Ph	T2-2	H	m.p.129-131°C
I-113	H	2-F-Ph	T2-1	H	m.p.111-111.5°C
I-114	H	2-F-Ph	T2-2	H	m.p.128-129°C
I-115	H	3-F-Ph	T2-1	H	m.p.137-138°C
I-116	H	3-F-Ph	T2-2	H	m.p.136-139°C
I-117	H	4-PhO-Ph	T2-1	H	m.p.132.5-134.5°C
I-118	H	4-PhO-Ph	T2-2	H	粘稠油状物
I-119	H	4-Br-Ph	T2-1	H	m.p.179-180.5°C
I-120	H	4-Et-Ph	T2-1	H	m.p.93-95°C
I-121	H	3-Pyridyl	T2-1	H	m.p.125-128°C
I-122	H	3-Pyridyl	T2-2	H	m.p.122-125.5°C
I-123	H	2-Furyl	T2-1	H	粘稠油状物
I-124	H	2-Thiazolyl	T2-1	H	粘稠油状物

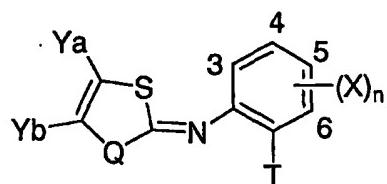
I-125	H	2-CF ₃ -Ph	T2-1	H	m. p. 150-151°C
I-126	H	Het44	T2-1	H	m. p. 91-94°C
I-127	H	2, 3-Cl ₂ -Ph	T2-1	H	m. p. 176-178°C
I-128	H	2, 3-Cl ₂ -Ph	T2-2	H	m. p. 130-131°C
I-129	H	3, 5-Cl ₂ -Ph	T2-1	H	粘稠油状物
I-130	H	3, 5-Cl ₂ -Ph	T2-2	H	粘稠油状物
I-131	H	2, 6-Cl ₂ -Ph	T2-1	H	m. p. 165-169°C
I-132	H	2, 6-Cl ₂ -Ph	T2-2	H	粘稠油状物
I-133	H	2, 5-Cl ₂ -Ph	T2-1	H	m. p. 173-175°C
I-134	H	2, 5-Cl ₂ -Ph	T2-2	H	粘稠油状物
I-135	H	2, 6-F ₂ -Ph	T2-1	H	m. p. 136-139°C
I-136	H	2-F-6-MeO-Ph	T2-1	H	m. p. 145-148°C
I-137	Cl	Ph	T2-1	H	m. p. 132-134°C
I-138	Cl	Ph	T2-2	H	粘稠油状物
I-139	Me	Ph	T2-1	H	m. p. 151.5-153°C
I-140	Me	Ph	T2-2	H	m. p. 127.5-129°C
I-141	Ph	Ph	T2-1	H	m. p. 134.5-136.5°C
I-142	Ph	Ph	T2-2	H	m. p. 180-182°C
I-143	H	Bu	T1	H	n _{D21.5} 1.5947
I-144	H	i-Bu	T1	H	n _{D21.6} 1.5882
I-145	H	s-Bu	T1	H	n _{D21.5} 1.5916
I-146	H	Hex	T1	H	n _{D21.3} 1.5799
I-147	H	c-Hex	T1	H	n _{D21.3} 1.5872
I-148	H	C ₂ F ₅	T1	H	n _{D21.6} 1.5290
I-149	H	(2, 4-Cl ₂ -PhO)CH ₂	T1	H	m. p. 104-105°C
I-150	H	Pyrrolidino-CH ₂	T1	H	m. p. 82-84°C
I-151	H	PhC(CF ₃)=N-OCH ₂	T1	H	n _{D20.6} 1.5817
I-152	H	PhN(Me)CH ₂	T1	H	油状物
I-153	H	PhCH=CH	T1	H	油状物
I-154	H	Ph ₃ PCH ₂	T1	H	m. p. 170°C < Cl 塩
I-155	H	Het43	T1	H	n _{D20.7} 1.6177
I-156	2-F-Ph	Me	T1	H	m. p. 66-71°C
I-157	Ph	Me	T1	H	m. p. 107-109°C
I-158	Ph	Et	T1	H	m. p. 91-94°C
I-159	Me(MeON=)C	Me	T1	H	m. p. 99-100°C
I-160	H	Bu	T2-1	H	m. p. 111-112°C
I-161	H	Bu	T2-2	H	油状物
I-162	H	i-Bu	T2-1	H	n _{D20.3} 1.5966
I-163	H	i-Bu	T2-2	H	m. p. 105-107°C
I-164	H	s-Bu	T2-1	H	n _{D20.3} 1.6004
I-165	H	s-Bu	T2-2	H	n _{D20.5} 1.5943
I-166	H	Hex	T2-1	H	m. p. 79-82°C
I-167	H	Hex	T2-2	H	m. p. 56-58°C
I-168	H	C ₂ F ₅	T2-1	H	油状物
I-169	H	C ₂ F ₅	T2-2	H	油状物
I-170	H	2, 4-Cl ₂ -PhOCH ₂	T2-1	H	m. p. 191-193°C
I-171	H	2, 4-Cl ₂ -PhOCH ₂	T2-2	H	油状物
I-172	H	Pyrroridino-CH ₂	T2-1	H	m. p. 151-154°C
I-173	H	PhC(CF ₃)=N-OCH ₂	T2-1	H	油状物
I-174	H	PhC(CF ₃)=N-OCH ₂	T2-2	H	油状物
I-175	H	PhN(Me)CH ₂	T2-1	H	油状物
I-176	H	PhN(Me)CH ₂	T2-2	H	油状物
I-177	H	Het43	T2-1	H	油状物
I-178	H	Het43	T2-2	H	油状物
I-179	H	c-Pr	T2-1	H	油状物
I-180	H	c-Pr	T2-2	H	m. p. 101-104°C
I-181	H	MeSCH ₂	T2-1	H	油状物
I-182	H	MeSCH ₂	T2-2	H	m. p. 144-148°C

I-183	2-F-Ph	Me	T2-1	H	油状物
I-184	2-F-Ph	Me	T2-2	H	油状物
I-185	Ph	Et	T2-1	H	m.p. 175-177°C
I-186	Ph	Et	T2-2	H	m.p. 126-129°C
I-187	H	Ph	T1	4-F	m.p. 74-76°C
I-188	H	Ph	T1	4-Me	m.p. 108-110°C
I-189	H	Ph	T1	5-Me	m.p. 105-107°C
I-190	H	Ph	T1	4-Cl	油状物
I-191	H	Ph	T1	5-Cl	m.p. 57-58°C
I-192	H	Ph	T1	4-CF ₃	m.p. 150-160°C HBr塩
I-193	H	2, 6-F ₂ -Ph	T1	4-F	m.p. 128-129°C
I-194	H	Ph	T1	4-MeO	m.p. 72-73°C
I-195	H	Ph	T1	4-MeO	m.p. 176-184°C HBr塩
I-196	H	2-Me-Ph	T1	H	m.p. 205-211°C HBr塩
I-197	H	2-F-Ph	T1	H	m.p. 191-197°C HBr塩
I-198	H	i-Pr	T1	H	m.p. 212-217°C HBr塩
I-199	H	2-CF ₃ -Ph	T1	H	m.p. 210°C <分解 HBr塩
I-200	H	c-Hex	T1	H	m.p. 208-211°C HBr塩
I-201	H	c-Pr	T1	H	m.p. 172-174°C HBr塩
I-202	BrCH ₂	H	T1	H	m.p. 180-183°C HBr塩
I-203	H	3, 5-F ₂ -Ph	T1	H	m.p. 21. 5. 5882
I-204	H	2, 6-F ₂ -Ph	T5	H	m.p. 172-174°C
I-205	H	2, 6-F ₂ -Ph	T6	H	m.p. 123-126°C
I-206	H	2-Pyridyl	T1	H	m.p. 98-99.5°C
I-207	H	1-Naphthyl	T1	H	m.p. 121-122°C
I-208	H	4-t-Bu-Ph	T1	H	m.p. 129-131°C
I-209	H	PhCO	T1	H	m.p. 25. 31. 5727
I-210	H	2, 3, 4, 5, 6-F ₅ -Ph	T1	H	m.p. 129-131°C
I-211	H	2-F-6-Cl-Ph	T1	H	m.p. 92-93°C
I-212	H	Ph	T1	3-F	m.p. 69-70°C
I-213	H	MeO ₂ C-(MeON=)C	T1	H	m.p. 111-112°C
I-214	H	Ph-(HON=)C	T1	H	m.p. 21. 81. 5154
I-215	H	Ph-(MeON=)C	T1	H	m.p. 21. 91. 5239
I-216	H	Ph-(PhCH ₂ ON=)C	T1	H	m.p. 21. 71. 5953
I-217	F	Ph	T1	H	m.p. 21. 71. 5117
I-218	H	2-F-6-MeO-Ph	T1	H	m.p. 112-114°C
I-219	H	Het11	T1	H	m.p. 115-116.5°C
I-220	H	2-F-4-F ₃ C-Ph	T1	H	m.p. 71-72°C
I-221	H	2-O ₂ N-Ph	T1	H	m.p. 107.5-109°C
I-222	H	2, 6-Me ₂ -Ph	T1	H	m.p. 133.5-134°C
I-223	H	2, 5-F ₂ -4-Cl-Ph	T1	H	m.p. 117-119°C
I-224	H	4, 6-Cl ₂ -2-Pyridyl	T1	H	粘稠油状物
I-225	H	2, 5-Cl ₂ -3-Thienyl	T1	H	m.p. 21. 71. 5356
I-226	H	2, 5-Me ₂ -Ph	T1	H	m.p. 21. 71. 5582
I-227	H	2-(PhCH ₂ O)-Ph	T1	H	m.p. 83-84.5°C
I-228	H	Het45	T1	H	m.p. 69-70.5°C
I-229	H	Ph-C(Br)=C(Br)	T1	H	粘稠油状物
I-230	H	2-Cl-Ph	T5	H	m.p. 203-205°C
I-231	H	FH ₂ C	T1	H	粘稠油状物
I-232	H	PhC≡C	T1	H	m.p. 85-86°C
I-233	B	Ph	T1	H	m.p. 21. 41. 6418
I-234	H	3-Br-4-Me ₂ N-Ph	T1	H	m.p. 106.5-108.5°C
I-235	H	2-HO-3, 4-Cl ₂ -Ph	T1	H	m.p. 143-145°C
I-236	H	4-CN-Ph	T1	H	m.p. 129-131°C
I-237	H	2, 6-Cl ₂ -4-Pyridyl	T1	H	m.p. 157-159°C
I-238	H	4-MeOC(=O)-Ph	T1	H	m.p. 104-106°C
I-239	H	4-Cl-Ph-C(Me) ₂ -	T1	H	m.p. 20. 81. 5361
I-240	H	Ph	T1	5-F	m.p. 105-106°C

I-241	H	4-Me-Ph	T1	4-Me	m.p. 100-101°C
I-242	H	4-n-Pr-Ph	T1	H	m.p. 70-71°C
I-243	H	4-n-Bu-Ph	T1	H	m.p. 43.5-44.5°C
I-244	H	2, 3, 6-F ₃ -Ph	T1	H	m.p. 83-84°C
I-245	H	4-MeS-Ph	T1	H	m.p. 78-80°C
I-246	H	2-Br-Ph	T1	H	m.p. 117-119°C
I-247	H	4-Hex-Ph	T1	H	n _{D20} . s1.5134
I-248	H	2, 6-F ₂ -Ph	T1	6-Me	m.p. 116-117°C
I-249	H	4-Me-Ph	T1	6-Me	n _{D21} . s1.4480
I-250	H	3-F-4-MeO-Ph	T1	H	m.p. 103.5-104.5°C
I-251	H	4-Me-Ph	T1	5-F	m.p. 123-124.5°C
I-252	H	2, 6-F ₂ -Ph	T1	5-F	m.p. 123-125°C
I-253	H	4-F ₂ HC-O-Ph	T1	H	n _{D20} . s1.5442
I-254	H	4-I-Ph	T1	H	m.p. 141-143°C
I-255	H	Het46	T1	H	n _{D20} . s1.5492
I-256	H	2-F-4-EtO-Ph	T1	H	n _{D20} . s1.5406
I-257	H	2-F-4-Cl-Ph	T1	H	m.p. 80.5-82°C
I-258	H	2-F-4-Br-Ph	T1	H	m.p. 62-63°C
I-259	H	2-F-6-I-Ph	T1	H	m.p. 94-96°C
I-260	H	3-F-6-Me-Ph	T1	H	m.p. 85.5-86.5°C
I-261	Me	4-F-Ph	T1	H	m.p. 90.5-91.5°C
I-262	H	2-F-5-CF ₃ -Ph	T1	H	m.p. 132-133°C
I-263	H	2-Me-3-F-Ph	T1	H	m.p. 123.5-125°C
I-264	H	2, 6-F ₂ -3-Me-Ph	T1	H	m.p. 108-110°C
I-265	H	2-Cl-4-F-Ph	T1	H	m.p. 122-124°C
I-266	H	2-F-5-Me-Ph	T1	H	m.p. 78.5-79.5°C
I-267	H	3-Cl-4-F-Ph	T1	H	n _{D21} . s1.5478
I-268	H	3-F-4-Me-Ph	T1	H	n _{D20} . s1.4930
I-269	H	2, 4-Me ₂ -Ph	T1	H	n _{D21} . s1.4915
I-270	H	2, 3-F ₂ -4-Me-Ph	T1	H	m.p. 70.5-71.5°C
I-271	H	2, 3-Me ₂ -Ph	T1	H	m.p. 93.5-95°C
I-272	H	3, 5-Me ₂ -Ph	T1	H	n _{D20} . s1.5326
I-273	H	3-Me-4-F-Ph	T1	H	m.p. 83.5-84.5°C
I-274	H	2, 6-F ₂ -Ph	T1	4-Me	m.p. 97-98°C
I-275	Me	4-Me-Ph	T1	4-Me	n _{D21} . s1.5495
I-276	H	2-F-4-MeO-Ph	T1	H	n _{D21} . s1.5922
I-277	H	2-Me-4-F-Ph	T1	H	m.p. 101-103°C
I-278	H	3-Me-4-Cl-Ph	T1	H	m.p. 78.5-80°C
I-279	H	2-F-4-Cl-5-Me-Ph	T1	H	m.p. 80.5-81.5°C
I-280	H	2-MeO-4-CF ₃ -Ph	T1	H	m.p. 149-151°C
I-281	H	2-F-4-Me-Ph	T1	H	m.p. 69-71°C
I-282	H	4-(Ph-C≡C)-Ph	T1	H	n _{D21} . s1.5366
I-283	H	4-(MeC(0))-Ph	T1	H	m.p. 93-95°C
I-284	H	2-MeO-4-MeS-Ph	T1	H	m.p. 150.5-152.5°C
I-285	H	2-(Me ₂ Si-C≡C)-Ph	T1	H	n _{D20} . s1.4962
I-286	H	4-(PhC(0))-Ph	T1	H	oil
I-287	H	2-F-5-Cl-Ph	T1	H	m.p. 134-135°C
I-288	H	2, 6-F ₂ -Ph	T1	4-t-Bu	m.p. 148-150°C
I-289	H	Het47	T1	H	m.p. 123-124°C
I-290	H	2, 6-F ₂ -4-Oct-Ph	T1	H	n _{D21} . s1.5030
I-291	H	2, 6-F ₂ -Ph	T1	4-PhCH ₂	m.p. 117-118°C
I-292	H	2, 6-F ₂ -4-Me-Ph	T1	H	n _{D26} . s1.5472
I-293	H	2, 6-F ₂ -Ph	T1	4-MeO	m.p. 105-106°C
I-294	H	2, 6-F ₂ -Ph	T1	4-Et	m.p. 67-68°C
I-295	Me	2, 6-F ₂ -Ph	T1	H	m.p. 118.4-119°C
I-296	H	2-F-4-PrO-Ph	T1	H	n _{D21} . s1.5193
I-297	H	2, 6-F ₂ -Ph	T1	6-MeO	m.p. 139-140°C
I-298	H	2, 6-F ₂ -Ph	T1	4-Pr	n _{D21} . s1.5966

I-299	H	2, 6-F ₂ -Ph	T1	5-Me	m. p. 75-76°C
I-300	H	2, 6-F ₂ -Ph	T1	4-Cl	m. p. 83-84°C
I-301	H	2, 6-F ₂ -Ph	T1	6-F	m. p. 143-146°C
I-302	H	2, 6-F ₂ -Ph	T1	5-MeO	m. p. 109-110°C
I-303	H	2, 6-F ₂ -Ph	T1	6-Cl	m. p. 122-122.5°C
I-304	H	2, 6-F ₂ -Ph	T1	5-Cl	m. p. 113.5-114.5°C
I-305	H	2, 6-F ₂ -Ph	T1	4-Ph	m. p. 161.5-162.8°C
I-306	H	2, 6-F ₂ -Ph	T1	4-i-Pr	m. p. 106-108°C
I-307	H	2, 6-F ₂ -Ph	T1	4-PhO	m. p. 139-140°C
I-308	Ph	H	T1	H	m. p. 49-50°C
I-309	H	5-CF ₃ -2-pyridyl	T1	H	m. p. 106-107°C
I-310	H	5-CF ₃ -2-pyridyl	T1	4-Me	m. p. 107-109°C
I-311	H	5-CF ₃ -2-pyridyl	T1	4-Et	n _D 21. 31.5782
I-312	2-Cl-Ph	Me	T1	H	n _D 20. 31.6253
I-313	H	2-Cl-PhCH ₂	T1	H	n _D 20. 31.6178
I-314	2-MeO-Ph	Me	T1	H	n _D 20. 31.5432
I-315	Het45	Me	T1	H	n _D 20. 31.5486
I-316	H	2, 6-F ₂ -Ph	T13	H	m. p. 125-128°C

〔第9表〕



N o.	Q	Ya	Yb	T	X	物性(m. p. 等)
II-1	O	H	Ph	T1	H	m. p. 67-69°C
II-2	O	H	2-Cl-Ph	T1	H	m. p. 86-87°C
II-3	O	H	2, 6-F ₂ -Ph	T1	H	m. p. 79-81°C
II-4	O	H	4-Br-Ph	T1	H	oil
II-5	O	H	2-MeO-Ph	T1	H	n _D 21. 31.5262
II-6	O	H	3-MeO-Ph	T1	H	m. p. 111-112°C
II-7	O	H	4-MeO-Ph	T1	H	m. p. 78-79°C
II-8	O	H	3-Cl-Ph	T1	H	m. p. 110-111°C
II-9	S	H	Ph	T1	H	oil
II-10	O	H	4-Cl-Ph	T1	H	m. p. 99-100°C
II-11	O	H	2-F-Ph	T1	H	m. p. 62-63°C
II-12	O	H	3-F-Ph	T1	H	m. p. 85-86°C
II-13	O	H	4-F-Ph	T1	H	m. p. 90-91°C
II-14	O	H	2-Me-Ph	T1	H	m. p. 78-79°C
II-15	O	H	3-Me-Ph	T1	H	m. p. 77-79°C
II-16	O	H	4-Me-Ph	T1	H	m. p. 59-60°C
II-17	O	H	2-MeO-Ph	T1	4-F	n _D 21. 31.5304
II-18	O	H	2, 5-F ₂ -Ph	T1	H	m. p. 97-98°C
II-19	O	H	1-Naphthyl	T1	H	oil
II-20	O	H	i-Bu	T1	H	n _D 20. 31.5630
II-21	O	H	3, 4-F ₂ -Ph	T1	H	m. p. 106-107°C
II-22	O	H	4-NO ₂ -Ph	T1	H	m. p. 123-125°C
II-23	O	H	4-CN-Ph	T1	H	m. p. 135-137°C

II-24	O	H	2-Cl-Ph	T1	4-F	n_{D20} 91.6218
II-25	S	H	4-Br-Ph	T1	H	m.p. 109-112°C
II-26	S	H	4-Me-Ph	T1	H	n_{D20} 91.5053
II-27	O	H	2-Br-Ph	T1	H	m.p. 74-75°C
II-28	O	H	4-MeS-Ph	T1	H	m.p. 84-85°C
II-29	S	H	4-F-Ph	T1	H	n_{D20} 81.6054
II-30	O	H	4-Et-Ph	T1	H	n_{D20} 71.6091
II-31	S	H	4-MeO-Ph	T1	H	m.p. 91-93°C
II-32	S	H	4-Cl-Ph	T1	H	m.p. 98-101°C
II-33	O	H	4-t-Bu-Ph	T1	H	oil
II-34	O	H	2, 6-Me ₂ -Ph	T1	H	n_{D20} 61.5560
II-35	O	Me	Ph	T1	H	n_{D20} 41.5522
II-36	S	H	2-F-Ph	T1	H	n_{D20} 71.6589
II-37	S	H	2-Me-Ph	T1	H	n_{D21} 11.6505
II-38	O	H	4-PhO-Ph	T1	H	oil
II-39	O	H	4-Hex-Ph	T1	H	m.p. 72-73°C
II-40	O	H	4-Bu-Ph	T1	H	n_{D20} 41.5584
II-41	O	H	4-Pr-Ph	T1	H	n_{D20} 41.5356
II-42	O	H	4-Me-Ph	T1	4-Me	n_{D21} 51.5528
II-43	S	H	2-Cl-Ph	T1	H	n_{D20} 11.6604
II-44	S	H	2-Br-Ph	T1	H	n_{D20} 81.6644
II-45	O	H	2, 4-F ₂ -Ph	T1	H	m.p. 100-101°C
II-46	O	H	2-F-6-Cl-Ph	T1	H	m.p. 87-88°C
II-47	O	H	4-CF ₃ O-Ph	T1	H	m.p. 79-80°C
II-48	O	H	4-CF ₃ -Ph	T1	H	m.p. 91-92°C
II-49	S	H	2, 6-F ₂ -Ph	T1	H	n_{D21} 61.6391
II-50	S	H	2, 5-F ₂ -Ph	T1	H	n_{D21} 11.6465
II-51	S	H	2, 4-F ₂ -Ph	T1	H	n_{D21} 91.6421
II-52	S	H	3, 4-F ₂ -Ph	T1	H	n_{D22} 61.6375
II-53	S	Me	Ph	T1	H	n_{D21} 81.6470
II-54	O	Br	Ph	T1	H	oil
II-55	O	H	2, 4-Cl ₂ -Ph	T1	H	m.p. 65-66°C
II-56	O	H	2, 5-Cl ₂ -Ph	T1	H	m.p. 128-129°C
II-57	O	H	3, 4-Cl ₂ -Ph	T1	H	m.p. 115-116°C
II-58	S	H	2, 3-F ₂ -Ph	T1	H	m.p. 52-53°C
II-59	O	Me	4-F-Ph	T1	H	m.p. 60-62°C
II-60	O	Et	Ph	T1	H	m.p. 68-69°C
II-61	O	H	2, 3-F ₂ -Ph	T1	H	m.p. 88-89°C
II-62	S	H	2, 5-Me ₂ -Ph	T1	H	n_{D20} 61.6480
II-63	S	Ph	Ph	T1	H	oil
II-64	O	H	2, 5-Me ₂ -Ph	T1	H	m.p. 80-82°C
II-65	O	H	2-F-4-Cl-Ph	T1	H	m.p. 85-87°C
II-66	O	Me	2, 5-F ₂ -Ph	T1	H	n_{D21} 21.6532
II-67	O	H	4-i-Pr-Ph	T1	H	m.p. 83-85°C
II-68	O	H	4-F-3-Cl-Ph	T1	H	m.p. 117-118°C
II-69	O	H	2-F-4-EtO-Ph	T1	H	m.p. 101-103°C
II-70	O	H	2-Me-5-F-Ph	T1	H	m.p. 55-56°C
II-71	O	H	3, 5-F ₂ -Ph	T1	H	m.p. 138-139°C
II-72	O	H	3, 5-Cl ₂ -Ph	T1	H	m.p. 84-85°C
II-73	O	H	3-F-4-MeO-Ph	T1	H	n_{D20} 21.6140
II-74	S	H	2-Me-5-F-Ph	T1	H	n_{D20} 41.6382
II-75	S	Me	4-F-Ph	T1	H	n_{D20} 21.6353
II-76	O	4-F-Ph	Me	T1	H	n_{D21} 31.5963
II-77	O	Me	2, 6-F ₂ -Ph	T1	H	n_{D21} 21.5792
II-78	O	Me	2-Cl-Ph	T1	H	n_{D21} 11.5571
II-79	O	H	2, 4-Me ₂ -Ph	T1	H	m.p. 55-57°C
II-80	O	H	2, 6-F ₂ -3-Me-Ph	T1	H	m.p. 88-89°C
II-81	O	H	2-Cl-4-F-Ph	T1	H	m.p. 100-101°C

II-82	O	H	2-F-5-Me-Ph	T1	H	m.p. 70-71°C
II-83	O	H	2, 4-Cl ₂ -Ph	T1	4-Me	m.p. 109-110°C
II-84	O	Me	4-Me-Ph	T1	H	m.p. 88-89°C
II-85	S	H	3, 5-F ₂ -Ph	T1	H	ND ₂₀ . 41. 6408
II-86	S	H	2, 4-Me ₂ -Ph	T1	H	ND ₂₀ . 91. 6401
II-87	S	H	2-F-5-Me-Ph	T1	H	ND ₂₀ . 61. 6442
II-88	S	Me	4-Me-Ph	T1	H	ND ₂₁ . 51. 6273
II-89	O	H	3-Me-4-F-Ph	T1	H	m.p. 83-84°C
II-90	O	H	2, 3-F ₂ -4-Me-Ph	T1	H	m.p. 91-92°C
II-91	O	Me	4-Me-Ph	T1	4-Me	m.p. 110-111°C
II-92	O	H	3-F-4-Me-Ph	T1	H	m.p. 77-78°C
II-93	O	H	2-Me-3-F-Ph	T1	H	m.p. 64-65°C
II-94	O	H	3-Me-4-Cl-Ph	T1	H	m.p. 109-110°C
II-95	O	Me	3, 4-F ₂ -Ph	T1	H	m.p. 72-73°C
II-96	O	H	2-Me-4-F-Ph	T1	H	m.p. 88-89°C
II-97	O	2-F-Ph	Me	T1	H	ND ₂₀ . 61. 6095
II-98	O	H	2-F-4-MeO-Ph	T1	H	m.p. 91-92°C
II-99	O	H	2, 3-Me ₂ -Ph	T1	H	m.p. 78-80°C
II-100	O	H	3, 5-Me ₂ -Ph	T1	H	m.p. 88-91°C
II-101	S	H	2-Cl-4-F-Ph	T1	H	ND ₂₀ . 41. 6421
II-102	S	H	2-F-4-Cl-Ph	T1	H	oil
II-103	S	H	2, 4-Cl ₂ -Ph	T1	H	ND ₂₀ . 91. 6686
II-104	S	Me	2, 6-F ₂ -Ph	T1	H	ND ₂₁ . 51. 6179
II-105	S	Me	2-Cl-Ph	T1	H	ND ₂₁ . 61. 6375
II-106	O	H	2-F-4-Cl-5-Me-Ph	T1	H	m.p. 90-91°C
II-107	S	H	4-CF ₃ -Ph	T1	H	ND ₂₁ . 91. 6191
II-108	S	H	2-F-4-CF ₃ -Ph	T1	H	ND ₂₁ . 71. 6132
II-109	S	H	4-CF ₃ O-Ph	T1	H	ND ₂₁ . 31. 6054
II-110	S	H	3-F-4-Me-Ph	T1	H	ND ₂₁ . 41. 6425
II-111	S	Me	4-Me-Ph	T1	4-Me	ND ₂₁ . 31. 5322
II-112	O	H	2-F-4-Me-Ph	T1	H	ND ₂₁ . 61. 4964
II-113	O	H	2-MeO-4-MeS-Ph	T1	H	m.p. 123-124°C
II-114	O	H	2-MeO-4-CF ₃ -Ph	T1	H	m.p. 137-138°C
II-115	S	Et	Ph	T1	H	ND ₂₁ . 61. 6435
II-116	S	H	2-F-6-Cl-Ph	T1	H	ND ₂₁ . 41. 6362
II-117	S	H	2, 3-Me ₂ -Ph	T1	H	ND ₂₁ . 51. 6456
II-118	S	H	1-naphthyl	T1	H	oil
II-119	S	Me	3, 4-F ₂ -Ph	T1	H	ND ₂₁ . 41. 6199
II-120	O	Me	2-F-Ph	T1	H	ND ₂₀ . 71. 5992
II-121	O	Et	4-Cl-Ph	T1	H	m.p. 98-99°C
II-122	O	Pr	Ph	T1	H	m.p. 65-66°C
II-123	O	Me	4-Cl-Ph	T1	H	m.p. 67-68°C
II-124	O	Me	2-Et-Ph	T1	H	ND ₂₁ . 31. 6048
II-125	O	Me	4-Br-Ph	T1	H	m.p. 82-84°C
II-126	O	Me	2, 4-F ₂ -Ph	T1	H	ND ₂₁ . 41. 5926
II-127	O	Me	3-Cl-Ph	T1	H	ND ₂₀ . 61. 6292
II-128	O	Me	3-Br-Ph	T1	H	ND ₂₀ . 41. 6363
II-129	O	H	3, 4-Me ₂ -Ph	T1	H	m.p. 94-95°C
II-130	O	Me	4-Et-Ph	T1	H	m.p. 82-84°C
II-131	O	Me	4-t-Bu-Ph	T1	H	m.p. 74-76°C
II-132	O	Me	3, 4-Cl ₂ -Ph	T1	H	m.p. 79-80°C
II-133	O	Me	4-Ph-Ph	T1	H	m.p. 163-165°C
II-134	O	Me	3, 4-F ₂ -Ph	T1	4-Me	m.p. 116-119°C
II-135	O	Me	4-F-Ph	T1	4-Me	m.p. 148-149°C
II-136	O	H	Het1	T1	H	m.p. 126-128°C
II-137	O	H	2-Cl-4-F-Ph	T1	H	m.p. 118-119°C
II-138	O	H	2-Me-3-Cl-Ph	T1	H	m.p. 91-92°C
II-139	O	H	2-Cl-4-Me-Ph	T1	H	ND ₂₀ . 11. 5477

II-140	O	H	3-Cl-4-Me-Ph	T1	H	m. p. 116-117°C
II-141	O	H	2-F-5-Cl-Ph	T1	H	m. p. 102-103°C
II-142	O	Me	2, 4-Cl ₂ -Ph	T1	H	oil
II-143	O	Et	4-MeO-Ph	T1	H	m. p. 113-115°C
II-144	O	Me	4-Me-Ph	T1	5-F	m. p. 79-80°C
II-145	O	Me	4-F-Ph	T1	5-F	m. p. 19-20°C
II-146	O	H	2-Cl-5-Me-Ph	T1	H	m. p. 78-79°C
II-147	O	Me	3-F-4-Cl-Ph	T1	H	ND ₂₀ . s1. 5646
II-148	O	Pr	4-F-Ph	T1	H	m. p. 62-63°C
II-149	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	H	m. p. 77-79°C
II-150	O	i-Pr	Ph	T1	H	m. p. 76-77.5°C
II-151	O	H	3, 4-(OH) ₂ -Ph	T1	H	crystal
II-152	O	Me	4-Me-Ph	T1	4-t-Bu	ND ₂₁ . s1. 5904
II-153	O	Pr	4-Br-Ph	T1	H	m. p. 80-81°C
II-154	O	Bu	Ph	T1	H	ND ₂₁ . s1. 5738
II-155	O	Me	3-F-4-Me-Ph	T1	H	ND ₂₁ . s1. 5094
II-156	S	Et	4-Me-Ph	T1	H	m. p. 71-72°C
II-157	O	Et	4-Me-Ph	T1	H	m. p. 67-69°C
II-158	O	Et	4-Me-Ph	T1	4-Me	m. p. 63-65°C
II-159	O	Me	4-MeO-Ph	T1	H	m. p. 128-130°C
II-160	O	Me	4-MeO-Ph	T1	4-Me	m. p. 119-120°C
II-161	S	Me	4-Cl-Ph	T1	H	m. p. 69-71°C
II-162	O	Me	4-Cl-Ph	T1	4-t-Bu	ND ₂₁ . s1. 5959
II-163	O	Me	4-Cl-Ph	T1	4-PhCH ₂	ND ₂₁ . s1. 6288
II-164	O	Me	4-Me-Ph	T1	4-PhCH ₂	ND ₂₁ . s1. 6295
II-165	O	Me	4-Me-Ph	T1	4-MeOC(O)	m. p. 112-114°C
II-166	S	Me	2, 6-F ₂ -Ph	T2-1	H	m. p. 145-147°C
II-167	S	Me	2, 6-F ₂ -Ph	T5	H	m. p. 127-128°C
II-168	S	Me	2, 6-F ₂ -Ph	T7	H	m. p. 61-63°C
II-169	O	Et	3-Cl-Ph	T1	H	ND ₂₀ . s1. 4721
II-170	S	Me	4-Br-Ph	T1	H	ND ₂₁ . s1. 4429
II-171	S	Me	3-Br-Ph	T1	H	ND ₂₂ . s1. 4836
II-172	S	Me	3-Cl-Ph	T1	H	ND ₂₁ . s1. 4062
II-173	S	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	H	ND ₂₂ . s1. 3160
II-174	O	Me	4-Me-Ph	T1	4-MeO	m. p. 97-99°C
II-175	O	Me	4-Cl-Ph	T1	4-MeO	m. p. 98-99°C
II-176	O	H	Het2	T1	H	m. p. 130-131°C
II-177	O	Me	2-F-4-CF ₃ -Ph	T1	H	m. p. 92-93°C
II-178	S	Me	2-F-4-CF ₃ -Ph	T1	H	ND ₂₁ . s1. 5568
II-179	O	H	3-F-4-Cl-Ph	T1	H	ND ₂₁ . s1. 5947
II-180	O	H	1-adamantyl	T1	H	m. p. 104-105°C
II-181	S	H	5-Br-2-thienyl	T1	H	ND ₂₁ . s1. 5486
II-182	S	Me	4-Et-Ph	T1	H	ND ₂₁ . s1. 6439
II-183	S	Me	4-t-Bu-Ph	T1	H	ND ₂₁ . s1. 5741
II-184	S	Et	2, 6-F ₂ -Ph	T1	H	ND ₂₁ . s1. 5724
II-185	S	Me	3-F-Ph	T1	H	ND ₂₁ . s1. 5008
II-186	O	H	2-F-4-PrO-Ph	T1	H	m. p. 62-63°C
II-187	O	Pr	3-Cl-Ph	T1	H	ND ₂₁ . s1. 5637
II-188	S	Pr	3-Cl-Ph	T1	H	ND ₂₁ . s1. 4974
II-189	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	4-Et	ND ₂₀ . s1. 5610
II-190	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	4-t-Bu	ND ₂₀ . s1. 4988
II-191	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	4-MeO	ND ₂₀ . s1. 5562
II-192	O	Me	4-Me-Ph	T5	4-Me	m. p. 163-164°C
II-193	S	Me	2, 4-F ₂ -Ph	T1	H	ND ₂₁ . s1. 3753
II-194	S	Me	3-Me-Ph	T1	H	ND ₂₁ . s1. 4223
II-195	O	Me	4-Me-Ph	T1	4-Et	m. p. 65-66°C
II-196	O	Me	4-Cl-Ph	T1	4-Et	m. p. 109-110°C
II-197	S	H	Het2	T1	H	ND ₂₀ . s1. 5535

II-198	S	Et	4-Cl-Ph	T1	H	oil
II-199	S	Me	3-CF ₃ -Ph	T1	H	oil
II-200	O	Me	3-Me-Ph	T1	H	ND21. 41.5766
II-201	O	Me	3-CF ₃ -Ph	T1	H	ND21. 41.5880
II-202	S	Et	3-SO ₃ H-4-MeO-Ph	T1	H	ND21. 01.5560
II-203	S	Me	2, 6-F ₂ -Ph	T1	4-Me	ND21. 11.5595
II-204	S	H	2, 6-F ₂ -Ph	T1	4-Me	ND21. 11.5616
II-205	S	Me	2, 5-F ₂ -Ph	T1	H	ND21. 41.4434
II-206	S	Me	2, 4-Cl ₂ -Ph	T1	H	ND21. 21.4644
II-207	O	Me	4-CF ₃ O-Ph	T1	H	m.p. 98-99°C
II-208	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	4-F	m.p. 93-94°C
II-209	O	Me	4-Cl-Ph	T1	4-F	m.p. 102-103°C
II-210	O	Me	4-Me-Ph	T1	4-F	ND21. 01.4920
II-211	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	6-MeO	m.p. 86-87°C
II-212	O	Me	4-Me-Ph	T1	6-MeO	m.p. 96-98°C
II-213	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	6-Me	m.p. 110-111°C
II-214	O	H	C(O)OH	T1	H	m.p. 122-123°C
II-215	S	Et	4-CF ₃ -Ph	T1	H	ND20. 01.5371
II-216	S	Et	4-F-Ph	T1	H	ND20. 01.5401
II-217	S	Et	4-CF ₃ O-Ph	T1	H	ND20. 01.5644
II-218	S	Me	3-CF ₃ O-Ph	T1	H	oil
II-219	S	Et	4-Br-Ph	T1	H	m.p. 90-92°C
II-220	S	Et	3-Br-Ph	T1	H	ND20. 01.4695
II-221	O	Et	4-F-Ph	T1	H	ND21. 21.5900
II-222	O	Et	3-Br-Ph	T1	H	ND21. 21.5139
II-223	O	Et	4-CF ₃ O-Ph	T1	H	ND21. 21.5296
II-224	O	Et	3, 4-Cl ₂ -Ph	T1	H	m.p. 101-102°C
II-225	O	Me	3-F-4-CF ₃ -Ph	T1	H	m.p. 74-75°C
II-226	S	Me	3-F-4-Me-Ph	T1	H	oil
II-227	O	Me	4-Cl-Ph	T1	4-Pr	m.p. 94.5-95°C
II-228	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	4-Pr	ND20. 01.5688
II-229	O	Me	4-Me-Ph	T1	4-Pr	ND20. 01.5874
II-230	O	Me	4-Cl-Ph	T1	6-MeO	m.p. 84.5-85°C
II-231	O	Me	4-Me-Ph	T1	6-Me	m.p. 91-91.5°C
II-232	O	Me	4-Cl-Ph	T1	6-Me	m.p. 99.5-100°C
II-233	O	Me	4-Me-Ph	T1	5-Me	m.p. 48.5-49.5°C
II-234	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	5-Me	m.p. 87.5-88.5°C
II-235	O	Me	4-Cl-Ph	T1	5-Me	m.p. 87-88°C
II-236	O	Me	4-Me-Ph	T1	4-Cl	m.p. 70-71°C
II-237	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	4-Cl	m.p. 85.6-86°C
II-238	O	Me	4-Cl-Ph	T1	4-Cl	m.p. 143.5-145°C
II-239	O	Me	4-Me-Ph	T1	6-F	m.p. 91.5-92.5°C
II-240	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	6-F	m.p. 67.5-68.5°C
II-241	O	Me	4-Cl-Ph	T1	6-F	m.p. 106-106.5°C
II-242	O	Me	4-Me-Ph	T1	5-MeO	m.p. 83-84°C
II-243	O	Me	4-Cl-Ph	T1	5-MeO	m.p. 94.5-95.5°C
II-244	O	Me	2-F-4-CF ₃ -Ph	T1	4-MeO	ND20. 21.3871
II-245	S	Et	3-F-Ph	T1	H	ND21. 01.4720
II-246	O	Me	4-i-Pr-Ph	T1	H	m.p. 63-65°C
II-247	O	Me	3-CF ₃ -4-F-Ph	T1	H	ND21. 01.4720
II-248	O	Et	4-Et-Ph	T1	H	ND21. 71.5044
II-249	O	Et	4-CF ₃ -Ph	T1	H	ND22. 01.5382
II-250	O	Me	3-CF ₃ O-Ph	T1	H	ND21. 01.5333
II-251	S	Me	3, 4-F ₂ -Ph	T1	H	ND21. 41.4630
II-252	S	Me	C(=N-OMe)Me	T1	H	ND21. 41.5022
II-253	S	Me	C(=N-OCH ₂ Ph)Me	T1	H	ND21. 41.4213
II-254	S	Me	C(=O)Me	T1	H	ND21. 31.5189
II-255	O	Me	Het3	T1	H	ND21. 31.5186

II-256	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	5-MeO	oil
II-257	O	Me	4-Me-Ph	T1	6-Cl	m. p. 108.5-109°C
II-258	O	Me	4-Me-Ph	T1	5-Cl	m. p. 81-82°C
II-259	S	Me	2, 6-F ₂ -Ph	T1/2	H	oil
II-260	O	H	Het4	T1	H	m. p. 116-117°C
II-261	O	Me	4-Me-Ph	T1	4-Ph	m. p. 114.5-115°C
II-262	S	Me	2-Me-5-F-Ph	T1	H	ND ₂₁ . s1.5480
II-263	S	Me	3, 4-Me ₂ -Ph	T1	H	ND ₂₁ . 41.5552
II-264	O	CO ₂ OMe	4-Cl-Ph	T1	H	ND ₂₁ . 21.5909
II-265	O	Me	4-Cl-Ph	T1	4-Ph	m. p. 115-116°C
II-266	O	Me	4-Cl-Ph	T1	4-Me	m. p. 145.9-146.5°C
II-267	O	Me	2, 6-F ₂ -Ph	T1	H	m. p. 46-49°C
II-268	O	Me	2, 4-Me ₂ -Ph	T1	H	m. p. 64-66°C
II-269	S	H	Het4	T1	H	oil
II-270	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	6-Cl	oil
II-271	O	Me	2-F-4-Br-Ph	T1	H	m. p. 83.5-85°C
II-272	O	Me	4-Me-Ph	T2-1	4-Me	oil
II-273	O	Et	4-t-Bu-Ph	T1	H	ND ₂₂ . s1.5620
II-274	O	Me	4-Me-Ph	T9	3-Me	m. p. 132.5-133°C
II-275	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	4-Ph	m. p. 134.3-135°C
II-276	O	Me	4-Me-Ph	T1	4-CF ₃	m. p. 91.6-91.8°C
II-277	O	Me	4-Me-Ph	T1	4-PhO	m. p. 82.7-83.5°C
II-278	O	Me	C(O)OH	T1	H	ND ₂₁ . s1.5432
II-279	O	Me	6-Cl-3-pyridyl	T1	H	m. p. 76-78°C
II-280	O	Me	2, 5-F ₂ -4-MeO-Ph	T1	H	m. p. 95-98°C
II-281	O	Me	3-Me-4-Cl-Ph	T1	H	ND ₂₁ . s1.5216
II-282	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	4-CF ₃	m. p. 86-91°C
II-283	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	4-i-Pr	ND ₂₁ . s1.5582
II-284	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	4-Me	m. p. 99.8-100.3°C
II-285	O	Me	4-Me-Ph	T1	4-i-Pr	ND ₂₁ . s1.5553
II-286	O	Me	2-F-4-Cl-Ph	T1	H	ND ₂₁ . s1.64.5°C
II-287	O	Me	4-pyridyl	T1	H	ND ₂₁ . s1.4248
II-288	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	4-Br	ND ₂₁ . s1.5943
II-289	O	Me	4-Cl-Ph	T1	4-CF ₃	m. p. 135.9-136.7°C
II-290	O	Me	4-Me-Ph	T1	4-Br	ND ₂₁ . s1.6258
II-291	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	4-OPh	ND ₂₁ . s1.5924
II-292	O	Me	2-F-4-CF ₃ -Ph	T1	4-Me	ND ₂₁ . s1.5629
II-293	O	Me	4-Me-Ph	T1	3-F	m. p. 79.5-80°C
II-294	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	3-F	m. p. 77-78°C
II-295	O	Me	2-F-4-CF ₃ -Ph	T1	4-F	m. p. 59-62°C
II-296	O	Me	2-F-4-CF ₃ -Ph	T1	4-Et	ND ₂₁ . s1.5644
II-297	O	Me	2-F-4-CF ₃ -Ph	T1	6-Me	m. p. 88-89°C
II-298	O	Me	4-t-Bu-Ph	T1	6-Me	m. p. 92-93°C
II-299	O	Me	1-(4-Cl-Ph)-c-Pr	T1	H	ND ₂₁ . s1.5586
II-300	O	Me	2-F-4-MeO-Ph	T1	H	m. p. 119-122°C
II-301	O	Me	2-F-4-EtO-Ph	T1	H	m. p. 70-71°C
II-302	O	Me	2-F-4-PrO-Ph	T1	H	m. p. 56-57°C
II-303	O	Me	2-F-4-i-PrO-Ph	T1	H	ND ₂₁ . s1.5604
II-304	O	Me	4-Me-Ph	T1	4, 6-Me ₂	oil
II-305	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	4, 6-Me ₂	oil
II-306	O	Me	2-CF ₃ -Ph	T1	H	ND ₂₁ . s1.5538
II-307	O	Me	3, 4, 5-F ₃ -Ph	T1	H	ND ₂₁ . s1.5418
II-308	O	Me	3-pyridyl	T1	H	ND ₂₁ . s1.4552
II-309	O	Et	2-F-4-CF ₃ -Ph	T1	H	ND ₂₁ . s1.564
II-310	O	Me	3-Me-4-F-Ph	T1	H	ND ₂₁ . s1.552
II-311	O	Me	(MeO) ₃ C	T1	H	oil
II-312	O	Me	Het5	T1	H	ND ₂₁ . s1.509
II-313	O	Me	4-Me-Ph	T1	4-OH	oil

II-314	O	Me	4-Me-Ph	T1	4-OMe	m.p. 171.5-172°C
II-315	O	Me	4-Me-Ph	T10	H	m.p. 155-157°C
II-316	O	Me	4-Me-Ph	T11	H	II _D 21.31.5937
II-317	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	4-CH ₂ OMe	II _D 21.21.5706
II-318	O	Me	4-Me-Ph	T1	4-CH ₂ OMe	II _D 21.21.6026
II-319	O	Me	3, 4-Me ₂ -Ph	T1	H	II _D 21.31.4968
II-320	O	Me	4-I-Ph	T1	H	m.p. 100-101°C oil
II-321	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	4-OH	II _D 21.21.5602
II-322	O	Me	Het6	T1	H	II _D 21.51.5188
II-323	O	Me	N≡C	T1	H	II _D 21.51.5097
II-324	O	Me	2-F-4-Cl-5-Me-Ph	T1	H	II _D 21.51.5097
II-325	O	Me	2-F-4-CF ₃ -Ph	T1	6-F	oil
II-326	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	6-CF ₃	m.p. 67-68°C
II-327	O	Me	4-Me-Ph	T1	6-CF ₃	m.p. 120-123°C
II-328	O	Me	4-Me-Ph	T1	3, 4-Me ₂	m.p. 91.5-93°C
II-329	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	4, 5-(OMe) ₂	m.p. 88-88.5°C
II-330	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	3-Me	II _D 21.61.5685
II-331	O	Me	4-Me-Ph	T1	4-CN	II _D 21.31.6132
II-332	O	Me	2-F-4-Me-Ph	T1	H	m.p. 85-87°C
II-333	O	Me	2-F-4-SMe-Ph	T1	H	m.p. 103-105°C
II-334	O	Me	Het7	T1	H	II _D 21.71.6554
II-335	O	Me	EtOC(O)	T1	H	II _D 21.71.6534
II-336	O	Me	Het8	T1	H	II _D 21.71.6528
II-337	O	Me	4-(2-Cl-Pr)-Ph	T1	H	II _D 21.81.5788
II-338	O	Me	Het9	T1	H	II _D 21.81.5412
II-339	O	Me	Het10	T1	H	II _D 21.51.5318
II-340	O	Me	MeC(O)	T1	H	II _D 21.61.5436
II-341	O	Me	2-F-4-CF ₃ -Ph	T1	3-F	oil
II-342	O	Me	2-F-4-CF ₃ -Ph	T1	4, 6-Me ₂	II _D 21.61.5664
II-343	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	4-N(Me)CO ₂ Me	oil
II-344	O	Me	4-Me-Ph	T1	4-N(Me)CO ₂ Me	oil
II-345	O	Me	4-Me-Ph	T1	4-NHMe	oil
II-346	O	Me	3-CF ₃ O-Ph	T1	6-Me	II _D 21.21.5773
II-347	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	4-NHMe	oil
II-348	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	4-CN	m.p. 59-61°C
II-349	O	Me	4-Me-Ph	T1	4-C(O)Me	m.p. 141-144°C
II-350	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	4-C(O)Me	m.p. 106-108°C
II-351	O	Me	4-Me-Ph	T1	4-C(Me)=NOH	m.p. 148-150°C
II-352	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	4-C(Me)=NOMe	II _D 21.21.5796
II-353	O	Me	2, 3, 4, 5-F ₄ -Ph	T1	H	II _D 21.11.4892
II-354	O	Me	4-CF ₃ SO ₂ O-Ph	T1	H	II _D 21.11.5186
II-355	O	Me	2-Cl-PhOC(O)	T1	H	II _D 20.81.5575
II-356	O	Me	2-Cl-PhCH ₂ OC(O)	T1	H	II _D 21.21.538
II-357	O	Me	2-Cl-PhNHC(O)NH	T1	H	m.p. 122-123°C
II-358	O	Me	Het11	T1	H	II _D 21.21.4764
II-359	O	Me	Het12	T1	H	m.p. 179-182°C
II-360	O	Me	Het13	T1	H	m.p. 189-192°C
II-361	O	Me	2-F-4, 5-Me ₂ -Ph	T1	H	II _D 21.41.5132
II-362	O	H	PhCH ₂	T1	H	II _D 21.41.5038
II-363	O	Me	2-Cl-PhOC(O)NH	T1	H	II _D 21.61.5737
II-364	O	Me	Het14	T1	H	II _D 21.21.4838
II-365	O	Me	3-F-4-CF ₃ -Ph	T1	H	m.p. 120-122°C
II-366	O	Me	4-Me-Ph	T1	6-OCH ₂ Ph	m.p. 90-91.5°C
II-367	O	Me	MeC(O)	T1	4-Br	II _D 21.21.6006
II-368	O	Me	MeC(=NOCH ₂ Ph)	T1	H	II _D 21.31.5562
II-369	O	Me	MeC(=NOMe)	T1	H	II _D 21.31.5088
II-370	O	Me	Het15	T1	H	m.p. 113-114°C
II-371	O	Me	4-Me-Ph	T5	H	m.p. 151-152°C

II-372	O	Me	4-CHF ₂ -Ph	T1	H	m. p. 114-115°C
II-373	O	Me	Het16	T1	H	m. p. 131-134°C
II-374	O	Me	HOC(0)	T1	4-Me	n _{D21.} 21.6006
II-375	O	Me	3, 4-F ₂ -Ph	T1	6-Me	n _{D21.} 21.5938
II-376	O	H	t-Bu	T1	H	n _{D21.} 61.5289
II-377	O	H	t-Bu	T1	4-Br	n _{D22.} 71.5527
II-378	O	Me	4-t-Bu-Ph	T1	4-Me	m. p. 117-118°C
II-379	O	Me	Het17	T1	H	m. p. 110-111°C
II-380	O	Me	CF ₃ CH ₂ OC(0)NH	T1	H	m. p. 86-87°C
II-381	O	Me	4-Me-Ph	T1	6-OSO ₂ Me	n _{D21.} 31.5247
II-382	O	Me	4-t-Bu-Ph	T1	4-Et	m. p. 84.5-85°C
II-383	O	Me	3-F-4-CF ₃ -Ph	T1	4-Et	oil
II-384	O	Me	3, 4-F ₂ -Ph	T1	4-Et	m. p. 109-110°C
II-385	O	Me	4-Me-Ph	T1	4-NMe ₂	m. p. 77.8-78.5°C
II-386	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	4-NMe ₂	m. p. 95.3-95.8°C
II-387	O	Me	3-F-4-CF ₃ -Ph	T1	4-Me	n _{D21.} 41.4994
II-388	O	Me	4-Cl-Ph	T1	4, 6-Me ₂	n _{D21.} 31.6076
II-389	O	Me	4-t-Bu-Ph	T1	4, 6-Me ₂	m. p. 104-106°C
II-390	O	Me	3-CF ₃ O-Ph	T1	4, 6-Me ₂	n _{D21.} 31.5618
II-391	O	Me	3-F-4-CF ₃ -Ph	T1	4, 6-Me ₂	n _{D21.} 41.5667
II-392	O	H	MeC(=NOH)	T1	H	n _{D21.} 41.5888
II-393	O	Me	t-BuNHC(0)NH	T1	H	n _{D21.} 21.5480
II-394	O	Me	s-BuNHC(0)NH	T1	H	n _{D21.} 21.5627
II-395	O	Me	CF ₃ CH ₂ NHC(0)NH	T1	H	m. p. 99-101°C
II-396	O	Me	Het18	T1	H	m. p. 156-157°C
II-397	O	Cl	4-Me-Ph	T1	H	oil
II-398	O	Me	3-CF ₃ O-Ph	T1	4-Et	n _{D21.} 31.5690
II-399	O	Me	3-CF ₃ O-Ph	T1	4-Me	n _{D21.} 41.5732
II-400	O	Me	4-Me-Ph	T1	6-OSO ₂ CF ₃	n _{D21.} 71.3945
II-401	O	H	Hex	T1	H	n _{D21.} 41.5132
II-402	O	Pen	Me	T1	H	n _{D21.} 31.4926
II-403	O	Me	MeC(=NOH)	T1	H	oil
II-404	O	MeS	4-Cl-Ph	T1	H	n _{D21.} 31.5336
II-405	O	Me	Het19	T1	H	m. p. 140-143°C
II-406	O	Me	Het20	T1	H	m. p. 156-157°C
II-407	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	4-SMe	m. p. 57.5-58.5°C
II-408	O	Me	4-Me-Ph	T1	4-SMe	m. p. 93.5-94°C
II-409	O	Me	4-Me-Ph	T1	4-S(0)Me	m. p. 106-107°C
II-410	O	Me	4-Me-Ph	T1	4-OC(0)Me	n _{D21.} 31.3994
II-411	O	Pr	Me	T1	H	n _{D21.} 71.5692
II-412	O	H	Bu	T1	H	n _{D21.} 71.5097
II-413	O	Me	Het21	T1	H	m. p. 178-180°C
II-414	O	Me	Het22	T1	H	m. p. 130-131°C
II-415	O	MeS(0)	4-Cl-Ph	T1	H	n _{D20.} 51.5138
II-416	O	MeSO ₂	4-Cl-Ph	T1	H	n _{D20.} 61.4335
II-417	O	H	t-BuCH ₂	T1	H	n _{D21.} 61.5301
II-418	O	Me	2-Cl-3-Pyridyl	T1	H	m. p. 94-95°C
II-419	O	Me	2-Me-4-thiazolyl	T1	H	m. p. 105-106°C
II-420	O	H	t-BuCH ₂	T1	4-Br	oil
II-421	O	Me	4-Br-2-thienyl	T1	H	m. p. 114-115°C
II-422	O	PhCH ₂ S	4-Cl-Ph	T1	H	n _{D21.} 21.5486
II-423	O	Me	Het24	T1	H	m. p. 125-126°C
II-424	O	Cl	3, 4-F ₂ -Ph	T1	H	m. p. 86-87°C
II-425	O	Cl	4-t-Bu-Ph	T1	H	n _{D20.} 71.5306
II-426	O	Me	Het25	T1	H	n _{D20.} 81.5548
II-427	O	Me	Het26	T1	H	oil
II-428	O	Me	Het27	T1	H	m. p. 114-115°C
II-429	O	Me	2-quinoquazalyl	T1	H	m. p. 117-118°C

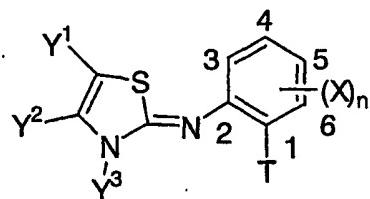
II-430	0	Me	4-CF ₃ -Ph	T1	H	^{IR} D _{20.} 41.5290
II-431	0	Me	4-(4-CF ₃ -Ph)-Ph	T1	H	m.p. 139-140°C
II-432	0	Me	Het28	T1	H	m.p. 39-40°C
II-433	0	Me	Het29	T1	H	^{IR} D _{20.} 81.5752
II-434	0	H	2-F-4-CF ₃ -Ph	T1	H	^{IR} D _{20.} 91.5809
II-435	0	Me	2-F-4-CF ₃ -Ph	T1	H	^{IR} D _{21.} 11.6510
II-436	0	Me	Het30	T1	H	^{IR} D _{20.} 01.5678
II-437	0	Me	Het31	T1	H	m.p. 79-80°C
II-438	0	Me	Het32	T1	H	^{IR} D _{20.} 01.5327
II-439	0	Me	Het33	T1	H	^{IR} D _{20.} 01.5431
II-440	0	Me	Het34	T1	H	^{IR} D _{20.} 81.5352
II-441	0	Me	2-quinolyl	T1	H	m.p. 99-100°C
II-442	0	Me	4-((CF ₃) ₂ CF)-Ph	T1	6-Me	m.p. 80-83°C
II-443	0	Me	4-((CF ₃) ₂ CF)-Ph	T1	H	oil
II-444	0	H	4-((CF ₃) ₂ CF)-Ph	T1	6-Me	m.p. 99-93°C
II-445	0	Me	4-((CF ₃) ₂ CF)-Ph	T1	4-Me	m.p. 107-108°C
II-446	0	Et	4-((CF ₃) ₂ CF)-Ph	T1	6-Me	oil
II-447	0	Et	4-((CF ₃) ₂ CF)-Ph	T1	H	oil
II-448	0	H	4-CF ₃ -Ph	T1	4-Me	m.p. 103-104°C
II-449	0	H	2-F-4-CF ₃ -Ph	T1	4-Me	m.p. 94-95°C
II-450	0	H	4-CF ₃ -Ph	T1	6-Me	m.p. 119-120°C
II-451	0	Me	5-Cl-2-thienyl	T1	H	^{IR} D _{20.} 41.5372
II-452	0	Me	5-Me-2-thienyl	T1	H	^{IR} D _{20.} 81.5726
II-453	0	H	4-CF ₃ -Ph	T1	4-Me-6-Cl	m.p. 158-162°C
II-454	0	H	4-CF ₃ -Ph	T1	6-Me-5-Cl	^{IR} D _{21.} 11.6492
II-455	0	H	2-F-4-CF ₃ -Ph	T1	4-Me-6-Cl	^{IR} D _{20.} 81.5082
II-456	0	H	2, 4-Cl ₂ -Ph	T1	6-Me	m.p. 100-101°C
II-457	0	Me	5-I-2-thienyl	T1	H	^{IR} D _{20.} 41.4710
II-458	0	Me	5-I-2-thienyl	T7	H	^{IR} D _{20.} 41.4890
II-459	0	Me	Het35	T1	H	^{IR} D _{20.} 11.5282
II-460	0	Me	5-CF ₃ -2-thienyl	T1	H	^{IR} D _{20.} 41.5145
II-461	0	Me	5-CF ₃ -2-thienyl	T7	H	^{IR} D _{20.} 41.4716
II-462	0	Me	Het35	T7	H	^{IR} D _{20.} 11.5437
II-463	0	Me	2-F-4-CF ₃ -Ph	T6	H	^{IR} D _{20.} 11.5632
II-464	0	3-CF ₃ -Ph	Me	T1	H	^{IR} D _{20.} 81.5774
II-465	0	3-Cl-Ph	Me	T1	H	^{IR} D _{20.} 71.6143
II-466	0	4-Me-Ph	Me	T1	H	^{IR} D _{20.} 81.5962
II-467	0	Me	Het36	T1	H	^{IR} D _{20.} 71.4752
II-468	0	2-Cl-Ph	Me	T1	H	^{IR} D _{20.} 21.5992
II-469	0	Me	4-Me-Ph	T13	H	m.p. 104-106°C
II-470	0	Me	3-thienyl	T1	H	^{IR} D _{20.} 21.5042
II-471	0	Me	2-F-5-CF ₃ -Ph	T1	H	^{IR} D _{20.} 81.5636
II-472	0	Me	2-F-3-CF ₃ -Ph	T1	H	^{IR} D _{20.} 81.5296
II-473	0	H	2, 4, 6-F ₃ -Ph	T1	H	^{IR} D _{20.} 81.5282
II-474	0	Me	Het37	T1	H	^{IR} D _{20.} 81.5154
II-475	0	Me	3-F-5-CF ₃ -Ph	T1	H	^{IR} D _{20.} 81.5076
II-476	0	Me	2, 4, 6-F ₃ -Ph	T1	H	^{IR} D _{20.} 81.4725
II-477	0	H	2, 4-Cl ₂ -Ph	T6	H	m.p. 71-73°C
II-478	0	H	2, 4-Cl ₂ -Ph	T6	4-Me	m.p. 113-114°C
II-479	0	Me	4-Me-Ph	T6	4-Me	m.p. 174-175°C
II-480	0	Me	3-F-5-CF ₃ -Ph	T6	H	^{IR} D _{20.} 81.5621
II-481	0	Me	Het37	T6	H	^{IR} D _{20.} 81.5621
II-482	0	H	4-Me-Ph	T6	H	m.p. 136-137°C
II-483	0	Me	2, 4, 6-F ₃ -Ph	T6	H	m.p. 61-62°C
II-484	0	H	2-Cl-4-CF ₃ -Ph	T1	H	^{IR} D _{20.} 81.5582
II-485	0	Me	Het37	T1	6-Me	^{IR} D _{20.} 81.5243
II-486	0	Me	2-F-4-CF ₃ -Ph	T14	H	m.p. 115-116°C
II-487	0	H	2-Cl-4-CF ₃ -Ph	T1	6-Me	m.p. 109-110°C

II-488	0	Me	4-((CF ₃) ₂ CF)-Ph	T6	H	oil
II-489	0	Me	4-CF ₃ -Ph	T6	H	m.p. 113-114°C
II-490	0	Me	Het38	T1	H	ND ₂₀ . 1. 5483
II-491	0	H	4-CF ₃ -Ph	T6	H	m.p. 175-176°C
II-492	0	H	2-Cl-4-CF ₃ -Ph	T6	H	ND ₂₁ . 1. 4650
II-493	0	Me	2-thienyl	T1	6-Me	ND ₂₀ . 81. 5409
II-494	0	Me	5-CF ₃ -2-thienyl	T1	6-Me	ND ₂₀ . 71. 4844
II-495	0	Me	2-thienyl	T1	H	ND ₂₁ . 01. 5172
II-496	0	Me	5-CF ₃ -3-thienyl	T1	H	ND ₂₁ . 11. 4925
II-497	0	Me	5-CF ₃ -3-thienyl	T1	6-Me	ND ₂₀ . 81. 4612
II-498	0	Me	5-CF ₃ -3-thienyl	T6	H	m.p. 42-43°C
II-499	0	Me	4-CF ₃ -Ph	T6	6-Me	m.p. 134-135°C
II-500	0	N≡C	Ph	T1	H	m.p. 103-105°C
II-501	0	Me	Het39	T1	H	m.p. 110-111°C
II-502	S	Me	2, 6-F ₂ -Ph	T6	H	m.p. 167-169°C
II-503	S	H	2, 6-F ₂ -Ph	T6	H	m.p. 136-138°C
II-504	S	Me	Ph	T6	H	m.p. 138-140°C
II-505	S	H	2, 3-Me ₂ -Ph	T6	H	m.p. 131-133°C
II-506	S	Me	3, 4-F ₂ -Ph	T6	H	m.p. 133-135°C
II-507	S	H	3, 4-F ₂ -Ph	T6	H	m.p. 155-156°C
II-508	O	Me	4-Me-Ph	T6	6-F	m.p. 153-155°C
II-509	O	Me	2-F-4-CF ₃ -Ph	T6	4-OMe	m.p. 103-105°C
II-510	O	Me	2-F-4-CF ₃ -Ph	T6	4-F	m.p. 99-104°C
II-511	O	Me	2-F-4-CF ₃ -Ph	T6	4-Et	m.p. 110-110°C
II-512	O	Me	2, 6-F ₂ -Ph	T6	H	m.p. 123-124°C
II-513	O	Me	2-F-4-CF ₃ -Ph	T15	H	m.p. 128-129°C
II-514	O	Me	Het37	T6	6-Me	m.p. 84-85°C
II-515	O	H	2-Cl-4-CF ₃ -Ph	T6	6-Me	m.p. 117-118°C
II-516	O	Me	5-CF ₃ -2-thienyl	T1	H	m.p. 147-148°C
II-517	O	Me	3-CF ₃ O-Ph	T6	6-Me	m.p. 126-128°C
II-518	O	Me	3-F-4-CF ₃ -Ph	T6	4, 6-Me ₂	m.p. 166-169°C
II-519	O	Me	3-F-4-CF ₃ -Ph	T6	6-Me	m.p. 120-122°C
II-520	O	Me	Het40	T1	H	oil
II-521	O	Me	5-CF ₃ -2-thienyl	T6	6-Me	m.p. 135-136°C
II-522	O	Me	3, 5-F ₂ -4-Me-Ph	T1	H	ND ₂₀ . 81. 4905
II-523	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T13	H	m.p. 112-115°C
II-524	O	Et	4-CF ₃ -Ph	T6	H	m.p. 122-124°C
II-525	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T6	3-F	m.p. 106-108°C
II-526	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T6	4, 6-Me ₂	m.p. 149-150°C
II-527	O	Me	Het33	T6	H	m.p. 161-163°C
II-528	O	Me	4-CF ₃ -2-thienyl	T1	H	ND ₂₁ . 21. 4635
II-529	O	Me	3-CF ₃ -2-thienyl	T1	H	ND ₂₁ . 21. 4956
II-530	O	Me	4-1-2-thienyl	T1	H	m.p. 135-136°C
II-531	O	Me	3, 5-F ₂ -4-Me-Ph	T1	6-Me	m.p. 70-71°C
II-532	O	Me	Het41	T1	H	ND ₂₁ . 21. 5796
II-533	O	Me	2-F-4-CF ₃ -Ph	T6	6-Me	m.p. 125-126°C
II-534	O	Me	4-((CF ₃) ₂ CF)-Ph	T16	H	m.p. 118-118.5°C
II-535	O	Me	2-F-4-CF ₃ -Ph	T6	4, 6-Me ₂	m.p. 71-73°C
II-536	O	H	Ph	T6	H	m.p. 161-163°C
II-537	O	H	2-Cl-Ph	T6	H	m.p. 107-108°C
II-538	O	H	3-Cl-Ph	T6	H	m.p. 163-165°C
II-539	O	H	2-Me-Ph	T6	H	m.p. 91-93°C
II-540	O	H	3-Me-Ph	T6	H	m.p. 142-144°C
II-541	O	H	2, 6-F ₂ -Ph	T6	H	m.p. 127-129°C
II-542	O	H	4-Br-Ph	T6	H	m.p. 142-144°C
II-543	O	H	4-F-Ph	T6	H	m.p. 166-167°C
II-544	O	H	3, 4-F ₂ -Ph	T6	H	m.p. 182-183°C
II-545	O	H	4-NO ₂ -Ph	T6	H	m.p. 179-180°C

II-546	O	H	4-(N≡C)-Ph	T6	H	m.p. 180-182°C
II-547	O	H	4-PhO-Ph	T6	H	m.p. 130-131°C
II-548	O	H	2, 4-F ₂ -Ph	T6	H	m.p. 120-122°C
II-549	O	H	4-i-Pr-Ph	T6	H	m.p. 121-123°C
II-550	O	Me	3-CF ₃ -2-thienyl	T1	6-Me	ND ₂₀ . s1. 4938
II-551	O	Me	4-CF ₃ -2-thienyl	T1	6-Me	ND ₂₀ . s1. 4754
II-552	O	Me	4-I-2-thienyl	T1	6-Me	m.p. 123-124°C
II-553	O	Me	3, 5-F ₂ -4-Me-Ph	T6	H	ND ₂₀ . s1. 5327
II-554	O	MeS	4-Cl-Ph	T6	H	m.p. 137-138°C
II-555	O	Me	3, 5-F ₂ -4-Me-Ph	T6	6-Me	m.p. 66-67°C
II-556	O	Me	2-F-4-CF ₃ -Ph	T1	6-NO ₂	ND ₂₀ . s1. 5038
II-557	O	Me	2-F-4-CF ₃ -Ph	T1	4-NO ₂	m.p. 97-98°C
II-558	O	Me	4-Cl-Ph	T13	H	m.p. 133-135°C
II-559	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T17	H	oil
II-560	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T18	H	m.p. 155.5-156°C
II-561	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T19	H	m.p. 101-102°C
II-562	O	Et	Ph	T6	H	m.p. 156-158°C
II-563	O	Me	4-F-Ph	T6	H	m.p. 106-108°C
II-564	O	Me	2-Cl-Ph	T6	H	m.p. 95-97°C
II-565	O	Me	3, 4-F ₂ -Ph	T6	H	m.p. 127-129°C
II-566	O	Et	4-Cl-Ph	T6	H	m.p. 102-104°C
II-567	O	Me	4-Cl-Ph	T6	H	m.p. 98-100°C
II-568	O	H	2, 4-Cl ₂ -Ph	T6	6-Me	m.p. 175-177°C
II-569	O	H	2-Me-4-thiazolyl	T1	H	m.p. 119-121°C
II-570	O	Me	4-Me-Ph	T20	H	m.p. 221-223°C
II-571	O	Me	4-Me-Ph	T21	H	m.p. 173-175°C
II-572	O	Me	2-F-4-CF ₃ -Ph	T13	H	m.p. 73-76°C
II-573	O	Me	4-Br-Ph	T6	H	m.p. 128-130°C
II-574	O	Me	2, 4-F ₂ -Ph	T6	H	m.p. 85-87°C
II-575	O	Me	4-Et-Ph	T6	H	m.p. 85-86°C
II-576	O	Me	2, 4-Cl ₂ -Ph	T6	H	m.p. 101-103°C
II-577	O	Me	4-F-3-CF ₃ -Ph	T6	H	m.p. 125-127°C
II-578	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T6	5-Me	m.p. 138-139°C
II-579	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T6	6-F	m.p. 105-109°C
II-580	O	Me	4-t-Bu-Ph	T6	5-OMe	m.p. 125-127°C
II-581	O	Me	4-Me-Ph	T6	5-Cl	m.p. 183-185°C
II-582	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T6	4-Ph	m.p. 192-194°C
II-583	O	Me	4-Me-Ph	T6	H	m.p. 145-147°C
II-584	O	Me	4-t-Bu-Ph	T6	H	m.p. 134-135°C
II-585	O	Me	3-Cl-Ph	T6	H	ND ₂₁ . z1. 5709
II-586	O	Me	3-CF ₃ O-Ph	T6	H	ND ₂₁ . z1. 5313
II-587	O	Me	4-Me-Ph	T6	6-Me	m.p. 153-155°C
II-588	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T6	4, 5-(OMe) ₂	m.p. 161-162°C
II-589	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T6	4-(NMe ₂)	m.p. 161-162°C
II-590	O	Me	4-t-Bu-Ph	T6	4-Me	m.p. 133-134°C
II-591	O	Me	3-CF ₃ O-Ph	T6	4-Et	m.p. 83-85°C
II-592	O	Me	3-CF ₃ O-Ph	T6	4-Me	m.p. 85-86°C
II-593	O	H	t-BuCH ₂	T6	H	m.p. 86-87°C
II-594	O	Me	4-Me-Ph	T2-1	H	oil
II-595	O	Me	4-Me-Ph	T22	H	oil
II-596	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T29	H	oil
II-597	O	Me	4-Me-Ph	T28	6-Me	oil
II-598	O	H	2, 4-Cl ₂ -Ph	T13	H	m.p. 92-95°C
II-599	O	Me	4-Me-Ph	T13	6-Me	oil
II-600	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T30	H	oil
II-601	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T31	H	oil
II-602	O	Me	4-Me-Ph	T32	H	m.p. 131-132°C
II-603	O	Me	4-Me-Ph	T33	H	m.p. 92-93°C

II-604	S	Me	4-Me-Ph	T28	H	oil
II-605	S	Me	4-Me-Ph	T13	H	m.p. 130-133°C
II-606	O	Me	3-Me-Ph	T13	H	m.p. 21. 5467
II-607	O	Me	4-Me-Ph	T34	H	oil
II-608	O	Me	4-Cl-Ph	T28	H	m.p. 21. 6094
II-609	O	Me	Het35	T6	H	m.p. 118-119°C
II-610	O	Me	4-Me-Ph	T6	4, 6-Me ₂	m.p. 149-151°C
II-611	O	Me	3-CF ₃ O-Ph	T6	4, 6-Me ₂	m.p. 123-124°C
II-612	O	Me	3-F-4-CF ₃ -Ph	T6	4-Et	m.p. 92-93°C
II-613	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T6	4-OMe	m.p. 101-102°C
II-614	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T6	6-Cl	m.p. 128-130°C
II-615	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T6	4-t-Bu	m.p. 111-112°C
II-616	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T6	6-OMe	m.p. 127-128°C
II-617	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T6	4-Et	m.p. 85-86°C
II-618	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T6	4-Me	m.p. 89-90°C
II-619	O	Me	4-CF ₃ -Ph	T6	4-Pr	m.p. 90-91°C

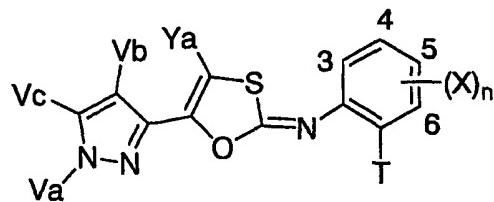
〔第10表〕



N o.	Y ¹	Y ²	Y ³	T	X	物性 (m.p. 等)	備考
III-1	H	Ph	Et	T1	H	m.p. 21. 5160	
III-2	H	Ph	Et	T2-1	H	m.p. 21. 5378	
III-3	H	Ph	Et	T2-2	H	m.p. 21. 4961	
III-4	H	Ph	Ph	T1	H	m.p. 21. 5702	
III-5	H	Ph	Ph	T2-1	H	m.p. 73-74°C	
III-6	H	Ph	Ph	T2-1	H	m.p. 21. 5112	
III-7	H	Ph	C(=O)OEt	T1	H	m.p. 122-123°C	
III-8	H	Ph	PhCH ₂	T1	H	m.p. 130-131°C	
III-9	H	Ph	PhCH ₂	T2-1	H	m.p. 134-136°C	
III-10	H	Ph	PhCH ₂	T2-2	H	m.p. 145-147°C	
III-11	H	Ph	Me ₂ N	T1	H	m.p. 88-89°C	
III-12	H	Ph	Me ₂ N	T2-1	H	m.p. 113-114°C	
III-13	H	Ph	Me ₂ N	T2-2	H	m.p. 133-134°C	
III-14	H	Ph	Me	CH ₂ COOPr	H	m.p. 21. 5711	
III-15	H	Ph	Me	CH ₂ COOBu	H	m.p. 21. 5545	
III-16	H	Ph	Me	CH ₂ COOPen	H	m.p. 21. 5762	
III-17	H	Ph	Me	CH ₂ COOCH ₂ CH ₂ OMe	H	m.p. 21. 5792	
III-18	H	Ph	Me	CH ₂ COOCH ₂ Ph	H	m.p. 139-141°C	
III-19	H	Ph	Me	CH ₂ CONH-i-Pr	H	m.p. 119-121°C	
III-20	H	Ph	Me	T26	H	m.p. 119-121°C	
III-21	H	Ph	Me	T27	H	m.p. 111-112°C	
III-22	H	H	PhCH ₂	T1	H	m.p. 21. 6236	
III-23	H	Me	PhCH ₂	T1	H	m.p. 21. 6136	

III-24	H	H	Ph	T1	H	m.p. 86-88°C
III-25	H	Ph	Pr	T1	H	m.p. 91-92°C
III-26	H	Ph	i-Pr	T1	H	m.p. 72-73°C
III-27	H	Me	PhMeN	T1	H	nd _{21.} 21.6190
III-28	H	Ph	H ₂ N	T1	H	200°C (decomp) HBr 咸
III-29	H	Ph	Me	T9	H	m.p. 112-113°C
III-30	H	2-Cl-Ph	Me	T9	H	油状物
III-31	H	Ph	Me	-O-T1	H	m.p. 119-121°C
III-32	H	Ph	Me	-O-T2-1	H	油状物
III-33	H	Ph	Me	T13	H	m.p. 161-163°C
III-34	H	Ph	Me	-NH-T1	H	m.p. 119-123°C
III-35	H	Ph	Me	-N(Me)-CO ₂ Me	H	nd _{21.} 21.6232
III-36	H	Ph	Me	-N(Me)-T1	H	m.p. 120-122°C
III-37	H	Ph	Me	-S-T1	H	m.p. 110-112°C
III-38	H	Ph	Me	-S-T6	H	m.p. 168-170°C
III-39	H	Ph	Me	T10	H	nd _{21.} 21.5285
III-40	H	Ph	Me	-O-Ph	H	m.p. 131-132°C
III-41	H	Ph	Me	T11	H	m.p. 134-136°C
III-42	H	Ph	Me	T23	H	m.p. 109-111°C
III-43	H	Ph	Me	T24	H	m.p. 88-90°C
III-44	H	Ph	Me	T25	H	m.p. 171-172°C

〔第 11 表〕

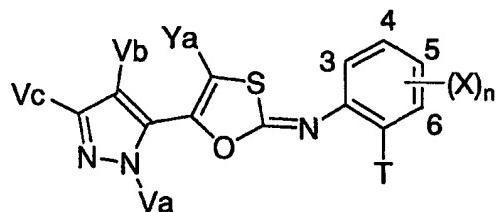


No.	Q	Va	Vb	Vc	Ya	T	X	物性 (m.p. 等)
IV-1	O	Me	Br	Me	Me	T1	H	nd _{21.} 21.4606
IV-2	O	Me	H	CF ₃	Me	T1	H	nd _{21.} 21.4310
IV-3	O	Me	H	CF ₃	Me	T1	6-Me	nd _{21.} 71.5206
IV-4	O	Me	Br	t-Bu	Me	T1	H	nd _{20.} 41.3572
IV-5	O	Me	H	t-Bu	Me	T1	H	nd _{20.} 51.4941
IV-6	O	Et	H	CF ₃	Me	T1	H	nd _{20.} 21.4269
IV-7	O	Me	H	CF ₃	Me	T1	4-Me	nd _{20.} 51.5496
IV-8	O	Et	H	CF ₃	Me	T1	4-Me	m.p. 64-65°C
IV-9	O	H	H	CF ₃	Me	T1	H	m.p. 95-96°C
IV-10	O	H	H	CF ₃	Me	T1	4-Me	m.p. 112.5-113.5°C
IV-11	O	i-Pr	H	CF ₃	Me	T1	H	nd _{24.} 01.4602
IV-12	O	Pr	H	CF ₃	Me	T1	H	nd _{22.} 81.4803
IV-13	O	Me	H	CF ₃	Me	T1	4-MeO	nd _{20.} 01.5468
IV-14	O	Et	H	CF ₃	Me	T1	6-Me	nd _{19.} 91.5440
IV-15	O	MeOCH ₂	H	CF ₃	Me	T1	H	nd _{19.} 51.4712
IV-16	O	N≡CCH ₂	H	CF ₃	Me	T1	H	nd _{22.} 11.4558
IV-17	O	CH ₂ =CHCH ₂	H	CF ₃	Me	T1	H	nd _{22.} 11.4995
IV-18	O	MeSO ₂	H	CF ₃	Me	T1	H	oil

IV-19	O	Me	H	Ph	Me	T1	H	m.p. 119-119.5°C
IV-20	O	Me	Br	Ph	Me	T1	H	m.p. 135.5-136°C
IV-21	O	Me	H	Me	Me	T1	H	m.p. 116-118°C
IV-22	O	PhCH ₂	H	CF ₃	Me	T1	H	ND ₂₀ . s1.4760
IV-23	O	Me	H	Cl	Me	T1	H	ND ₂₀ . s1.4696
IV-24	O	Me	Br	Cl	Me	T1	H	m.p. 90-91°C
IV-25	O	Me	H	Cl	Me	T1	4-Me	ND ₂₀ . s1.4671
IV-26	O	Me	Br	Cl	Me	T1	4-Me	ND ₂₀ . 41.5103
IV-27	O	Pr	H	CF ₃	Me	T1	6-Me	ND ₂₁ . 11.4620
IV-28	O	Me	H	OCHF ₂	Me	T1	H	ND ₂₀ . 71.5632
IV-29	O	Me	H	OCHF ₂	Me	T1	6-Me	ND ₂₀ . 71.5482
IV-30	O	N≡CCH ₂	H	CF ₃	Me	T1	H	ND ₁₉ . s1.5619
IV-31	O	Me ₃ SiCH ₂	H	CF ₃	Me	T1	H	ND ₂₀ . 41.4707
IV-32	O	F ₂ HC	H	CF ₃	Me	T1	H	ND ₂₁ . 11.5150
IV-33	O	MeSCH ₂	H	CF ₃	Me	T1	H	ND ₂₂ . s1.4858
IV-34	O	Cl ₂ C=CHCH ₂	H	CF ₃	Me	T1	H	ND ₂₂ . 41.5234
IV-35	O	Me ₂ SO ₂	H	CF ₃	Me	T1	H	ND ₂₀ . s1.5460
IV-36	O	i-Bu	H.	CF ₃	Me	T1	H	m.p. 52.5-54°C
IV-37	O	Bu	H	CF ₃	Me	T1	H	ND ₂₀ . 41.5033
IV-38	O	MeOC(O)CH ₂	H	CF ₃	Me	T1	H	ND ₂₀ . s1.5216
IV-39	O	Ph	H	t-Bu	Me	T1	H	ND ₂₀ . 11.5206
IV-40	S	Me	H	CF ₃	Me	T1	H	ND ₂₀ . s1.5337
IV-41	O	c-Pr-CH ₂	H	CF ₃	Me	T1	H	ND ₁₈ . s1.5913
IV-42	O	Me	H	Et	Me	T1	H	m.p. 74-75°C
IV-43	O	Me	H	CF ₃	Me	T1	6-Me	m.p. 101-103°C
IV-44	O	Me	H	i-Pr	Me	T1	H	m.p. 73-75°C
IV-45	O	Me	H	Bu	Me	T1	H	m.p. 81-82°C
IV-46	O	Me	Pr	Me	Me	T1	H	m.p. 76-78°C
IV-47	O	Me	H	Pr	Me	T1	H	m.p. 99-101°C
IV-48	O	Pr	H	CF ₃	Me	T1	4-Me	ND ₁₈ . s1.5492
IV-49	O	CF ₃ CH ₂ CH ₂	H	CF ₃	Me	T1	H	ND ₁₉ . s1.5246
IV-50	O	Me	H	CF ₃	Cl	T1	6-Me	ND ₁₁ . o1.4919
IV-51	O	FCH ₂ CH ₂ CH ₂	H	CF ₃	Me	T1	H	ND ₂₀ . s1.4965
IV-52	O	Cl ₂ CCH ₂	H	CF ₃	Me	T1	H	m.p. 112-113°C
IV-53	O	Me	H	CF ₃	Me	T1	H	ND ₂₀ . s1.4724
IV-54	O	Me	H	CF ₃	Me	T1	4-Me	ND ₂₀ . s1.5378
IV-55	O	Me	H	CF ₃	Me	T6	6-Me	m.p. 152-154°C
IV-56	O	F ₂ HC	H	CF ₃	Me	T1	4-Me	ND ₁₈ . s1.5436
IV-57	O	F ₂ HC	H	CF ₃	Me	T1	6-Me	ND ₁₈ . 41.5199
IV-58	O	H ₂ C=CHCH ₂	H	CF ₃	Me	T1	6-Me	ND ₁₈ . s1.5348
IV-59	O	H	H	CF ₃	Me	T1	6-Me	m.p. 105-106.5°C
IV-60	O	F ₂ HCCCH ₂	H	CF ₃	Me	T1	H	ND ₂₂ . 11.4460
IV-61	O	Me	H	CF ₃	Et	T1	H	ND ₂₀ . s1.4782
IV-62	O	Me	H	CF ₃	Et	T1	6-Me	ND ₂₀ . s1.5300
IV-63	O	Me	H	CF ₃	Et	T6	H	m.p. 160-161°C
IV-64	O	Me	H	CF ₃	Et	T6	6-Me	m.p. 136-137°C
IV-65	O	Me	H	CF ₃	Me	T6	H	m.p. 182-183°C
IV-66	O	Me	H	CF ₃	Me	T5	6-Me	m.p. 184.5-185.5°C
IV-67	O	Me	H	CF ₃	H	T6	H	m.p. 173-174°C
IV-68	O	Me	H	CF ₃	Me	T1	6-F	oil
IV-69	O	Me	H	CF ₃	Me	T6	6-F	m.p. 134-134.5°C
IV-70	O	Me	H	CF ₃	Me	T1	6-Cl	oil
IV-71	O	Me	H	CF ₃	Me	T6	6-Cl	m.p. 143-145°C
IV-72	O	Me	H	CF ₃	Me	T14	6-Me	oil
IV-73	O	2-pyridyl	H	CF ₃	Me	T1	H	m.p. 150-152°C
IV-74	O	Me	H	CF ₃	H	T6	6-Me	m.p. 72-73°C
IV-75	O	Et	H	CF ₃	Me	T6	H	m.p. 130-133°C
IV-76	O	F ₂ HC	H	CF ₃	H	T6	H	m.p. 109-110°C

IV-77	O	Me	H	CF ₃	Me	T6	4-Me	m.p. 114-115°C
IV-78	O	Et	H	CF ₃	Me	T6	4-Me	m.p. 149.5-150°C
IV-79	O	Pr	H	CF ₃	Me	T6	H	m.p. 73-74°C
IV-80	O	Me	H	CF ₃	Me	T15	H	m.p. 134-135°C
IV-81	O	Me	H	CF ₃	Me	T18	6-Me	m.p. 140-144°C
IV-82	O	Me	H	CF ₃	Me	T16	H	m.p. 151-153°C
IV-83	O	Me	H	CF ₃	Me	T13	H	oil
IV-84	O	Me	H	t-Bu	Me	T1	6-Me	m.p. 103-105°C
IV-85	O	Me	H	t-Bu	Me	T6	6-Me	m.p. 132-134°C
IV-86	O	Me	H	CF ₃	Me	T18	H	n _D ₁₉ . 71.5457
IV-87	O	Me	H	CF ₃	Me	T9	H	m.p. 62-64°C
IV-88	O	Me	H	Me	Me	T6	H	m.p. 170-173°C
IV-89	O	Me	H	CF ₃	Me	T28	H	m.p. 100-103°C
IV-90	O	Me	H	CF ₃	Me	T13	4-Me	oil
IV-91	O	Me	H	CF ₃	Me	T2-1	H	m.p. 140-142°C
IV-92	O	Me	H	CF ₃	Me	T22	H	oil
IV-93	O	Me	H	CF ₃	Me	T13	6-Me	m.p. 55-58°C
IV-94	O	Me	H	CF ₃	Me	T28	6-Me	oil
IV-95	O	Me	H	CF ₃	Et	T13	H	n _D ₂₁ . 71.4830
IV-96	O	Me	H	CF ₃	Me	T32	H	m.p. 98-99°C
IV-97	O	Me	H	CF ₃	Me	T33	H	m.p. 129-130°C
IV-98	O	Me	H	Cl	Me	T6	H	m.p. 168-170°C
IV-99	O	Et	H	CF ₃	Me	T6	6-Me	m.p. 124-125°C

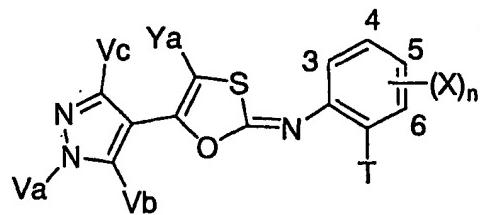
〔第12表〕



N o.	Q	Va	Vb	Vc	Ya	T	X	物性(m.p.等)
V-1	O	Me	H	CF ₃	Me	T1	H	n _D ₂₁ . 71.4868
V-2	O	Me	H	Cl	Me	T1	H	n _D ₂₁ . 71.5118
V-3	O	Me	Br	Cl	Me	T1	H	oil
V-4	O	Me	Br	Me	Me	T1	H	n _D ₂₁ . 71.4222
V-5	O	Me	H	Cl	H	T1	H	n _D ₂₀ . 71.5933
V-6	O	Me	H	CF ₃	Me	T1	4-Me	n _D ₂₀ . 71.5484
V-7	O	i-Pr	H	CF ₃	Me	T1	H	n _D ₂₂ . 71.4179
V-8	O	Me	Me	Me	H	T1	H	n _D ₂₂ . 71.5032
V-9	O	Me	H	CF ₃	Me	T1	4-MeO	m.p. 117-119°C
V-10	O	N≡CCH ₂	H	CF ₃	Me	T1	H	n _D ₂₂ . 71.4950
V-11	O	CH ₂ =CHCH ₂	H	CF ₃	Me	T1	H	n _D ₂₂ . 71.4836
V-12	O	MeSO ₂	H	CF ₃	Me	T1	H	m.p. 125-127°C
V-13	O	PhCH ₂	H	CF ₃	Me	T1	H	n _D ₂₀ . 71.4799
V-14	O	t-Bu	H	CF ₃	Me	T1	H	n _D ₂₀ . 71.4842
V-15	O	CH≡CHCH ₂	H	CF ₃	Me	T1	H	n _D ₁₉ . 71.5000
V-16	O	Me ₂ SiCH ₂	H	CF ₃	Me	T1	H	n _D ₂₀ . 71.5223

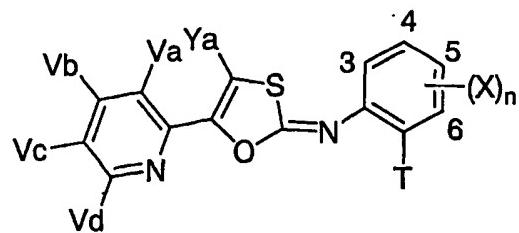
V-17	0	F ₂ HC	H	CF ₃	Me	T1	H	n_{D21} . 11.4728
V-18	0	MeSCH ₂	H	CF ₃	Me	T1	H	n_{D22} . 21.5231
V-19	0	Cl ₂ C=CHCH ₂	H	CF ₃	Me	T1	H	n_{D22} . 61.5476
V-20	0	i-Bu	H	CF ₃	Me	T1	H	n_{D20} . 31.4566
V-21	0	MeOC(O)CH ₂	H	CF ₃	Me	T1	H	n_{D20} . 21.5170
V-22	0	c-Pr-CH ₂	H	CF ₃	Me	T1	H	m.p. 62-63°C
V-23	0	F ₃ CCH ₂ CH ₂	H	CF ₃	Me	T1	H	n_{D19} . 61.5173
V-24	0	FCH ₂ CH ₂ CH ₂	H	CF ₃	Me	T1	H	n_{D20} . 11.5240
V-25	0	H ₂ C=CHCH ₂	H	CF ₃	Me	T1	H	n_{D18} . 71.5430
V-26	0	F ₂ HCCCH ₂	H	CF ₃	Me	T1	H	n_{D22} . 11.4966

〔第13表〕



N o.	Q	Va	Vb	Vc	Ya	T	X	物性(m.p.等)	
VI-1	0	Me		Cl	Cl	Me	T1	H	m.p. 84-87°C
VI-2	0	Me	H	CF ₃	Me	T1	H	m.p. 78.5-80°C	
VI-3	0	Me	H	Cl	H	T1	H	n_{D22} . 61.5773	
VI-4	0	Me	H	H	Me	T1	H	n_{D19} . 61.5240	
VI-5	0	2-pyridyl	H	H	Me	T1	H	n_{D20} . 61.5362	
VI-6	0	Pr	H	H	Me	T1	H	n_{D22} . 21.5236	
VI-7	0	Pr	H	H	Me	T1	6-Me	m.p. 69-70°C	
VI-8	0	i-Pr	H	H	Me	T1	H	n_{D21} . 41.4756	
VI-9	0	1-Et-Pr	H	H	Me	T1	H	n_{D21} . 11.5191	
VI-10	0	1-Et-Pr	H	H	Me	T1	6-Me	oil	
VI-11	0	t-Bu	H	H	Me	T1	H	n_{D23} . 51.5516	
VI-12	0	t-Bu	H	H	Me	T1	6-Me	n_{D19} . 61.5487	
VI-13	0	CF ₃ CH ₂	H	H	Me	T1	6-Me	m.p. 86-89°C	
VI-14	0	i-Pr	H	H	Me	T1	6-Me	n_{D21} . 41.4835	
VI-15	0	Me	H	H	Me	T1	6-Me	m.p. 92-93°C	
VI-16	0	Et	H	H	Me	T1	6-Me	n_{D22} . 31.5693	
VI-17	0	Ph	H	H	Me	T1	H	m.p. 114-115°C	
VI-18	0	Ph	H	H	Me	T1	6-Me	m.p. 132-133°C	
VI-19	0	Het48	H	H	Me	T1	H	m.p. 122-123°C	
VI-20	0	Het48	H	H	Me	T1	6-Me	m.p. 100-101°C	
VI-21	0	Ph	H	H	Me	T6	H	m.p. 184-185°C	
VI-22	0	Pr	H	H	Me	T6	6-Me	m.p. 107-108°C	
VI-23	0	Het23	H	H	Me	T1	6-Me	m.p. 145-146°C	
VI-24	0	Het23	H	H	Me	T1	H	m.p. 119.5-120°C	
VI-25	0	Pr	H	H	Me	T13	H	n_{D19} . 61.5768	
VI-26	0	i-Pr	H	H	Me	T6	H	m.p. 150-151°C	

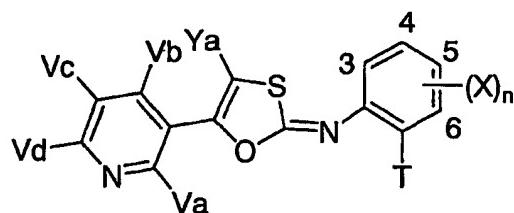
〔第14表〕



N.o.	Q	Va	Vb	Vc	Vd	Ya	T	X	物性(m.p.等)
VII-1	O	H	H	CF ₃	H	Me	T1	H	m.p. 64-67°C
VII-2	O	H	H	CF ₃	H	H	T1	H	m.p. 97-99°C
VII-3	O	H	H	CF ₃	H	Me	T1	4-MeO	m.p. 86-86.5°C
VII-4	O	H	H	CF ₃	H	Me	T1	4-Et	m.p. 65-65.8°C
VII-5	O	H	H	CF ₃	H	Me	T1	4-Me	m.p. 112-113°C
VII-6	O	H	H	CF ₃	H	Me	T1	6-Me	m.p. 116-117°C
VII-7	O	H	H	CF ₃	H	Me	T1	4, 6-Me ₂	m.p. 106-107°C
VII-8	O	H	Cl	H	H	Me	T1	H	m.p. 99-100°C
VII-9	O	H	H	H	H	Me	T1	H	m.p. 75-77°C
VII-10	O	H	H	H	Me	Me	T1	H	n _{D20} . s1.5154
VII-11	O	H	H	CF ₃	H	Cl	T1	H	oil
VII-12	O	H	H	H	Cl	Me	T1	H	m.p. 75-76°C
VII-13	S	H	H	CF ₃	H	Me	T1	H	n _{D21} . s1.6526
VII-14	O	H	H	Et	H	Me	T1	H	n _{D19} . s1.5674
VII-15	O	H	H	i-Pr	H	Me	T1	H	n _{D19} . s1.5616
VII-16	O	H	H	Bu	H	Me	T1	H	
VII-17	O	H	H	Et	H	Me	T1	6-Me	m.p. 99-100°C
VII-18	O	H	H	i-Pr	H	Me	T1	6-Me	m.p. 114-115°C
VII-19	O	H	H	Bu	H	Me	T1	6-Me	n _{D21} . s1.5810
VII-20	O	H	H	CF ₃	H	Et	T1	H	m.p. 60-61°C
VII-21	O	H	H	CF ₃	H	Et	T1	6-Me	m.p. 94-95°C
VII-22	O	H	H	CF ₃	H	Et	T6	H	m.p. 143-145°C
VII-23	O	H	H	Cl	H	Me	T1	H	m.p. 74-75°C
VII-24	O	H	H	Cl	H	Me	T1	6-Me	m.p. 69-70°C
VII-25	O	H	H	CF ₃	H	Et	T6	6-Me	m.p. 159-160°C
VII-26	O	H	H	Cl	H	Me	T6	H	m.p. 127-129°C
VII-27	O	H	H	Cl	H	Me	T6	6-Me	m.p. 114-115°C
VII-28	O	EtO	H	CF ₃	H	H	T1	H	n _{D21} . s1.5907
VII-29	O	EtO	H	CF ₃	H	H	T6	H	m.p. 170-171°C
VII-30	O	H	H	CF ₃	H	Me	T6	H	m.p. 141-143°C
VII-31	O	H	H	CF ₃	H	Me	T6	4-Me	m.p. 124-125°C
VII-32	O	Cl	H	Cl	H	Me	T1	H	n _{D21} . s1.5361
VII-33	O	Cl	H	Cl	H	H	T1	H	n _{D21} . s1.5679
VII-34	O	F	H	F	H	Me	T1	H	n _{D20} . s1.5233
VII-35	O	Cl	H	Cl	H	Me	T1	6-Me	n _{D21} . s1.5078
VII-36	O	Cl	H	Cl	H	H	T1	6-Me	m.p. 92-93°C
VII-37	O	F	H	F	H	Me	T1	6-Me	n _{D21} . s1.5729
VII-38	O	Cl	H	Cl	H	Me	T1	4-Me	n _{D21} . s1.5570
VII-39	O	Cl	H	Cl	H	H	T1	4-Me	n _{D21} . s1.5310

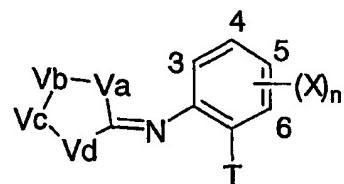
VII-40	0	H	H	CF ₃	H	Me	T6	4, 6-Me ₂	m. p. 119-120°C
VII-41	0	H	H	Cl	H	H	T1	6-Me	n _D 21.41.5319
VII-42	0	H	H	CF ₃	H	Me	T6	6-Me	m. p. 158-159°C
VII-43	0	H	H	Cl	H	Me	T1	4-Me	n _D 21.31.5468
VII-44	0	H	H	CF ₃	H	H	T6	H	m. p. 165-167°C
VII-45	0	Cl	H	Cl	H	Me	T6	H	m. p. 127-129°C
VII-46	0	Cl	H	Cl	H	H	T6	H	m. p. 119-120°C
VII-47	0	F	H	F	H	Me	T1	4-Me	n _D 20.71.4902
VII-48	0	Cl	H	Cl	H	H	T6	4-Me	m. p. 92-94°C
VII-49	0	H	H	Cl	H	H	T6	4-Me	m. p. 132-134°C
VII-50	0	Cl	H	Cl	H	Me	T6	4-Me	m. p. 131-133°C
VII-51	0	Cl	H	Cl	H	H	T6	6-Me	m. p. 96-98°C
VII-52	0	F	H	F	H	Me	T6	6-Me	m. p. 85-87°C
VII-53	0	Cl	H	Cl	H	Me	T6	6-Me	n _D 21.21.5058

〔第15表〕



N o.	Q	Va	Vb	Vc	Vd	Ya	T	X	物性(m. p. 等)
VIII-1	0	H	H	H	CF ₃	H	T1	H	n _D 24.21.4715
VIII-2	0	H	H	H	CF ₃	H	T6	H	n _D 20.21.5218

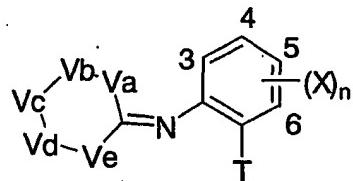
〔第16表〕



N o.	-Va-Vb-Vc-Vd-	T	X	物性(m. p. 等)	備考
IX-1	-S-C(=CH ₂)-CH ₂ -N(Me)-	T1	H	n _D 21.61.5078	
IX-2	-S-C(=CH ₂)-CH ₂ -N(Me)-	T2-1	H	n _D 21.61.4735	
IX-3	-S-C(=O)-CH ₂ -N(Me)-	T1	H	油状物	
IX-4	-S-CH(Me)-C(=O)-N(Me)-	T1	H	油状物	

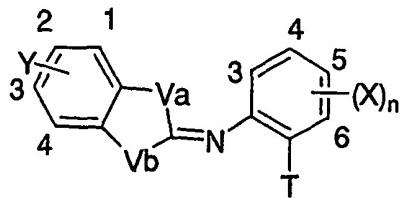
IX-5	$-S-CH(Me)-C(=O)-N(Me)-$	T2-1	H	油状物
IX-6	$-S-CH_2-C(OH)(C_2F_5)-N(Me)-$	T1	H	m.p. 178-180°C HBr塩
IX-7	$-S-CH_2-C(=O)-N(Me)-$	T1	H	m.p. 74-75°C
IX-8	$-N(Me)-CH_2-C(=O)-N(Me)-$	T1	H	m.p. 57-59°C
IX-9	$-O-C(Ph)=N-N(Me)-$	T1	H	m.p. 97-99°C
IX-10	$-S-C(Ph)=N-N(Me)-$	T1	H	m.p. 76-77°C
IX-11	$-S-C(Ph)=N-N(Me)-$	T2-1	H	m.p. 127-129°C
IX-12	$-S-C(Ph)=N-N(Me)-$	T2-2	H	m.p. 97-98°C
IX-13	$-S-CH(CH_2Br)-CH_2-N(Me)-$	T1	H	m.p. 177-179°C HBr塩
IX-14	$-S-CH_2-CH(Ph)-O-$	T1	H	粘稠油状物
IX-15	$-N(Me)-CH_2-CH_2-N(Me)-$	T1	H	$n_{D21.3} 1.4973$
IX-16	$-S-CH_2-C(=N-Ph)-N(Me)-$	T1	H	$n_{D20.7} 1.5326$
IX-17	$-O-CH=C(Ph)-N(Me)-$	T1	H	粘稠油状物
IX-18	$-S-C(Cl_2)-C(=O)-N(Me)-$	T1	H	$n_{D21.8} 1.6031$
IX-19	$-S-CH_2-C(=N-(2,6-F_2-Ph))-N(Me)-$	T1	H	m.p. 78-79°C
IX-20	$-S-CH_2-CH(4-Br-Ph)-O-$	T1	H	$n_{D22.5} 1.5656$
IX-21	$-S-CH_2-CH(4-F-Ph)-O-$	T1	H	$n_{D22.2} 1.5710$

〔第17表〕



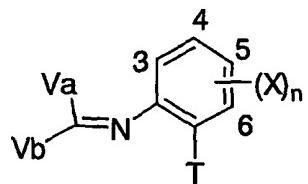
N o .	$-V_a-V_b-V_c-V_d-V_e-$	T	X	物性 (m.p. 等)
X-1	$-S-CH_2-CH_2-CH_2-N(Ph)-$	T1	H	$n_{D21.1} 1.5728$
X-2	$-S-CH_2-C(Ph)=N-N(Me)-$	T1	H	m.p. 85-86°C
X-3	$-N(Me)-CH_2=CH_2-CH(Ph)-S-$	T1	H	$n_{D21.3} 1.6292$
X-4	$-N=C(OMe)-CH=C(OMe)-N(Me)-$	T1	H	m.p. 122-123°C
X-5	$-CH=CH-CH=C(F)-N(Me)-$	T1	H	$n_{D21.7} 1.5286$
X-6	$-S-CH_2-C(Me)=N-N(Ph)-$	T1	H	m.p. 101-104°C
X-7	$-CH=CH-CH=CH-N(-OMe)-$	T1	H	$n_{D21.6} 1.5728$
X-8	$-S-CH_2-C(=O)-N(Me)-N(Me)-$	T1	H	$n_{D20.7} 1.5728$
X-9	$-CH_2-S-CH=C(Ph)-N(Me)-$	T1	H	$n_{D20.4} 1.6251$
X-10	$-CH_2-S-CH=C(Ph)-N(Me)-$	T2-1	H	粘稠油状物

〔第18表〕



No.	Va	Vb	Y	T	X	物性(m.p.等)
XI-1	S	NMe	H	T1	H	ND21. s1. 5512
XI-2	O	NMe	H	T1	H	ND21. s1. 5526
XI-3	S	S	H	T1	H	ND21. 41. 5032
XI-4	S	NMe	2-Cl	T1	H	ND21. 21. 5232
XI-5	S	NMe	2-MeO	T1	H	ND21. s1. 5276
XI-6	NMe	NMe	H	T1	H	ND21. o1. 5380
XI-7	S	O	H	T1	H	ND21. 21. 5459

〔第19表〕



No.	Va	Vb	T	X	物性(m.p.等)
XIII-1	PhC(=O)CH ₂ S	Me ₂ N	T1	H	ND21. 71. 6084
XIII-2	(2-MeO-Ph)C(=O)CH ₂ S	Me ₂ N	T1	H	ND21. 61. 5325
XIII-3	(3-MeO-Ph)C(=O)CH ₂ S	Me ₂ N	T1	H	ND21. s1. 5274
XIII-4	(4-MeO-Ph)C(=O)CH ₂ S	Me ₂ N	T1	H	ND21. 71. 5053
XIII-5	(3-Cl-Ph)C(=O)CH ₂ S	Me ₂ N	T1	H	ND21. s1. 4970
XIII-6	(4-Cl-Ph)C(=O)CH ₂ S	Me ₂ N	T1	H	ND21. s1. 5545
XIII-7	(2-F-Ph)C(=O)CH ₂ S	Me ₂ N	T1	H	ND21. s1. 5166
XIII-8	(3-F-Ph)C(=O)CH ₂ S	Me ₂ N	T1	H	ND21. 41. 5544
XIII-9	(4-F-Ph)C(=O)CH ₂ S	Me ₂ N	T1	H	ND21. s1. 5281
XIII-10	(2-Me-Ph)C(=O)CH ₂ S	Me ₂ N	T1	H	ND21. s1. 5382
XIII-11	(3-Me-Ph)C(=O)CH ₂ S	Me ₂ N	T1	H	ND21. s1. 5022
XIII-12	(4-Me-Ph)C(=O)CH ₂ S	Me ₂ N	T1	H	ND21. s1. 5221
XIII-13	(2, 6-F ₂ -Ph)C(=O)CH ₂ S	Me ₂ N	T1	H	ND21. 21. 5647
XIII-14	(2-Cl-Ph)C(=O)CH ₂ S	Me ₂ N	T1	H	ND21. s1. 5364
XIII-15	(1-naphthyl)C(=O)CH ₂ S	Me ₂ N	T1	H	ND21. 41. 5342
XIII-16	(2, 5-F ₂ -Ph)C(=O)CH ₂ S	Me ₂ N	T1	H	ND21. s1. 5860
XIII-17	(4-NO ₂ -Ph)C(=O)CH ₂ S	Me ₂ N	T1	H	ND20. s1. 5216
XIII-18	(2-Br-Ph)C(=O)CH ₂ S	Me ₂ N	T1	H	ND20. s1. 5756
XIII-19	(4-MeS-Ph)C(=O)CH ₂ S	Me ₂ N	T1	H	ND20. s1. 5932

XII-20	(2, 6-Me ₂ -Ph)C(=O)CH ₂ S	Me ₂ N	T1	H	ND _{20.} 51.5232
XII-21	(4-PhO-Ph)C(=O)CH ₂ S	Me ₂ N	T1	H	ND _{20.} 41.6214
XII-22	(4-Hex-Ph)C(=O)CH ₂ S	Me ₂ N	T1	H	ND _{20.} 51.5778
XII-23	(4-Bu-Ph)C(=O)CH ₂ S	Me ₂ N	T1	H	ND _{20.} 41.5884
XII-24	(4-Pr-Ph)C(=O)CH ₂ S	Me ₂ N	T1	H	ND _{20.} 41.5936
XII-25	(4-Me-Ph)C(=O)CH ₂ S	Me ₂ N	T1	H	ND _{21.} 51.5592
XII-26	(2, 4-F ₂ -Ph)C(=O)CH ₂ S	Me ₂ N	T1	H	ND _{21.} 51.5104
XII-27	(4-CF ₃ O-Ph)C(=O)CH ₂ S	Me ₂ N	T1	H	ND _{21.} 71.5640
XII-28	(4-CF ₃ -Ph)C(=O)CH ₂ S	Me ₂ N	T1	H	ND _{21.} 81.5653
XII-29	(4-Et-Ph)C(=O)CH ₂ S	Me ₂ N	T1	H	ND _{20.} 81.5790
XII-30	MeS	Me ₂ SiCH ₂ S	T1	H	ND _{21.} 01.5676
XII-31	MeS	PhCH(OH)CH ₂ S	T1	H	粘稠油状物

〔第20表〕

No.	¹ H NMR (CDCl ₃ δ (ppm))			
I-50	2.38(s, 3H), 3.26(s, 3H), 3.58(s, 3H), 3.73(s, 3H), 5.71(s, 1H), 6.80-7.60(m, 9H)			
I-51	2.39(s, 3H), 3.28(s, 3H), 3.55(s, 3H), 3.85(s, 3H), 5.70(s, 1H), 6.54(s, 1H), 6.90-7.40(m, 8H)			
I-52	3.23(s, 3H), 3.56(s, 3H), 3.74(s, 3H), 5.73(s, 1H), 6.90-7.80(m, 9H)			
I-53	3.28(s, 3H), 3.59(s, 3H), 3.86(s, 3H), 5.75(s, 1H), 6.56(s, 1H), 6.80-7.60(m, 8H)			
I-54	3.31(s, 3H), 3.59(s, 3H), 3.75(s, 3H), 5.79(s, 1H), 7.10-7.85(m, 14H)			
I-58	3.30(s, 3H), 3.60(s, 3H), 3.90(s, 3H), 5.90(s, 1H), 6.55(s, 1H), 7.00-8.15(m, 11H)			
I-59	3.38(s, 3H), 3.61(s, 3H), 3.78(s, 3H), 5.94(s, 1H), 7.00-7.60(m, 8H)			
I-76	2.94(s, 3H), 3.32(s, 3H), 3.54(s, 3H), 3.82(s, 3H), 4.20(s, 2H), 5.57(s, 1H), 6.49(s, 1H), 6.65-7.45(m, 9H)			
I-79	3.19(s, 3H), 3.61(s, 3H), 3.67(s, 2H), 5.85(s, 1H), 7.00-7.80(m, 7H)			
I-118	3.24(s, 3H), 3.51(s, 3H), 3.76(s, 3H), 5.63(s, 1H), 6.45(s, 1H), 6.60-7.60(m, 13H)			
I-123	3.43(s, 3H), 3.55(s, 3H), 3.73(s, 3H), 6.00(s, 1H), 6.35-6.65(m, 2H), 6.90-7.60(m, 6H)			
I-124	3.56(s, 3H), 3.63(s, 3H), 3.75(s, 3H), 6.28(s, 1H), 7.10-7.45(m, 6H), 7.86(d, J=3.6Hz, 1H)			
I-129	3.22(s, 3H), 3.53(s, 3H), 3.72(s, 3H), 5.77(s, 1H), 6.90-7.50(m, 8H)			
I-130	3.25(s, 3H), 3.54(s, 3H), 3.82(s, 3H), 5.77(s, 1H), 6.49(s, 1H), 6.80-7.55(m, 7H)			
I-132	3.08(s, 3H), 3.52(s, 3H), 3.82(s, 3H), 5.82(s, 1H), 6.53(s, 1H), 6.80-7.55(m, 7H)			
I-134	3.12(s, 3H), 3.52(s, 3H), 3.82(s, 3H), 5.75(s, 1H), 6.50(s, 1H), 6.90-7.55(m, 7H)			
I-138	3.17(s, 3H), 3.60(s, 3H), 3.85(s, 3H), 6.53(s, 1H), 6.85-7.75(m, 9H)			
I-152	3.92(s, 3H), 3.35(s, 3H), 3.57(s, 3H), 3.61(s, 2H), 4.20(s, 2H), 5.61(s, 1H), 6.75-7.45(m, 9H)			
I-161	0.94(t, J=5.4Hz, 3H), 1.20-1.75(m, 4H), 2.2-2.6(m, 2H),			

3.30 (s, 3H), 3.49 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 5.42 (s, 1H),
 6.47 (s, 1H), 6.85-7.35 (m, 4H)
 I-168 3.44 (s, 3H), 3.57 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 6.44 (s, 1H),
 7.05-7.35 (m, 4H), 7.38 (s, 1H)
 I-169 3.47 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.87 (s, 3H), 6.45 (s, 1H),
 6.54 (s, 1H), 7.05-7.35 (m, 4H),
 I-171 3.49 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.86 (s, 3H), 4.85 (s, 2H),
 5.98 (s, 1H), 6.56 (s, 1H), 6.90-7.55 (m, 7H)
 I-173 3.23 (s, 3H), 3.44 (s, 3H), 3.67 (s, 3H), 4.91 (s, 2H),
 5.91 (s, 1H), 6.85-7.45 (m, 10H)
 I-174 3.31 (s, 3H), 3.41 (s, 3H), 3.86 (s, 3H), 4.98 (s, 2H),
 5.99 (s, 1H), 6.53 (s, 1H), 7.05-7.50 (m, 9H)
 I-175 2.91 (s, 3H), 3.30 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.72 (s, 3H),
 4.17 (s, 2H), 5.57 (s, 1H), 6.70-7.45 (m, 10H)
 I-177 2.10 (s, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.70 (s, 3H),
 5.15 (s, 2H), 6.00 (s, 1H), 6.90-7.70 (m, 9H)
 I-178 2.10 (s, 3H), 3.50 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.90 (s, 3H),
 5.20 (s, 2H), 6.10 (s, 1H), 6.90-7.50 (m, 9H)
 I-179 0.55-1.15 (m, 4H), 1.40-1.70 (m, 1H), 3.43 (s, 3H),
 3.54 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 5.43 (s, 1H), 6.95-7.50 (m, 5H)
 I-181 2.05 (s, 3H), 3.38 (s, 3H), 3.44 (s, 2H), 3.55 (s, 3H),
 3.75 (s, 3H), 5.68 (s, 1H), 6.95-7.37 (m, 5H)
 I-183 2.04 (s, 3H), 3.37 (s, 3H), 3.58 (s, 3H), 3.74 (s, 3H),
 6.85-7.65 (m, 9H)
 I-184 2.03 (s, 3H), 3.40 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.82 (s, 3H),
 6.50 (s, 1H), 6.90-7.45 (m, 8H)
 I-190 3.30 (s, 3H), 3.60 (s, 3H), 3.62 (s, 2H), 5.82 (s, 1H),
 6.92-7.45 (m, 8H)
 I-224 3.57 (s, 8H), 6.16 (s, 1H), 6.90-7.60 (m, 6H)
 I-231 3.48 (s, 3H), 3.59 (s, 3H), 3.63 (s, 3H),
 5.12 (d, J=48.4Hz, 2H), 6.06 (d, J=6.6Hz, 1H),
 7.00-7.10 (m, 2H), 7.20-7.30 (m, 2H)
 I-286 3.41 (s, 3H), 3.62 (s, 3H), 3.68 (s, 2H), 5.92 (s, 1H);
 6.99-7.96 (m, 13H)
 II-9 3.64 (s, 3H), 3.64 (s, 2H), 6.59 (s, 0.4H), 6.68 (s, 0.6H),
 7.04-7.32 (m, 9H)
 II-19 3.66 (s, 3H), 3.72 (s, 2H), 6.37 (s, 1H), 7.10-8.35 (m, 11H)
 II-33 1.34 (s, 9H), 3.62 (s, 3H), 3.69 (s, 2H), 6.33 (s, 1H),
 7.05-7.65 (m, 8H)
 II-38 3.61 (s, 3H), 3.68 (s, 2H), 6.27 (s, 1H), 6.95-7.7 (m, 13H)
 II-54 3.65 (s, 3H), 3.68 (s, 2H), 6.9-8.15 (m, 9H)
 II-63 3.67 (s, 2H), 3.70 (s, 3H), 7.05-7.32 (m, 14H)
 II-102 3.64 (s, 5H), 6.84 (s, 0.4H), 6.94 (s, 0.6H), 7.03-7.33 (m, 7H)
 II-118 3.70 (s, 5H), 6.45 (s, 0.4H), 6.54 (s, 0.6H),
 6.90-8.19 (m, 11H)
 II-142 1.97 (s, 3H), 3.65 (s, 3H), 3.67 (s, 2H), 7.05-7.51 (m, 7H)
 II-151 3.61 (s, 3H), 3.64 (s, 2H), 6.25 (s, 1H), 6.85-7.55 (m, 7H),
 8.53 (s, 1H), 8.67 (s, 1H)
 II-198 1.05-1.24 (m, 3H), 2.36-2.58 (m, 2H), 3.64 (s, 2H),
 3.66 (s, 3H), 6.98-7.38 (m, 8H)
 II-199 2.07 (s, 1.2H), 2.17 (s, 1.8H), 3.64 (s, 2H), 3.69 (s, 3H),
 7.00-7.65 (m, 8H)
 II-218 2.08 (s, 1.2H), 2.17 (s, 1.8H), 3.64 (s, 2H), 3.68 (s, 3H),
 6.98-7.50 (m, 8H)
 II-226 2.07 (s, 1.2H), 2.16 (s, 1.8H), 2.26 (s, 1.8H), 2.30 (s, 1.8H),
 3.64 (s, 2H), 3.68 (s, 3H), 6.90-7.35 (m, 7H)
 II-256 2.27 (s, 3H), 3.66 (s, 3H), 3.66 (s, 2H), 3.81 (s, 2H),
 6.82-7.00 (m, 3H), 7.71 (m, 4H)

II-259	1.95 (s, 3H), 3.95 (s, 3H), 6.85-7.60 (m, 12H)
II-269	1.80 (m, 4H), 2.76 (m, 4H), 3.64 (s, 5H), 6.52 (s, 0.4H), 6.61 (s, 0.6H), 7.05-7.70 (m, 7H)
II-270	2.27 (s, 3H), 3.66 (s, 3H), 3.89 (s, 2H), 6.98-7.27 (m, 3H), 7.70 (m, 4H)
II-272	2.21 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 3.64 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 6.86-7.49 (m, 8H)
II-304	2.20 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 3.62 (s, 3H), 3.70 (s, 2H), 6.73 (s, 1H), 6.82 (s, 1H), 7.23 (d, J=7.6Hz, 2H), 7.47 (d, J=7.6Hz, 2H)
II-305	2.27 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 3.63 (s, 3H), 3.70 (s, 2H), 6.72 (s, 1H), 6.81 (s, 1H), 7.70 (m, 4H)
II-311	3.29 (s, 9H), 3.58 (s, 3H), 3.64 (s, 2H), 6.40 (s, 1H), 6.90-7.50 (m, 4H)
II-313	2.15 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 3.57 (s, 2H), 3.61 (s, 3H), 6.55 (m, 2H), 7.08 (m, 1H), 7.20 (d, J=8.0Hz, 2H), 7.42 (d, J=8.0Hz, 2H)
II-321	2.23 (s, 3H), 3.58 (s, 3H), 3.63 (s, 2H), 6.54 (s, 1H), 6.56 (d, J=8.3Hz, 1H), 6.66 (br, s, 1H), 7.10 (d, J=8.3Hz, 1H), 7.67 (m, 4H)
II-325	2.09 (d, J=2.8Hz, 3H), 3.67 (s, 3H), 3.74 (s, 2H), 6.87-7.74 (m, 6H)
II-341	2.09 (s, 3H), 3.65 (s, 3H), 3.67 (s, 2H), 6.65-7.74 (m, 6H)
II-343	2.29 (s, 3H), 3.31 (s, 3H), 3.66 (s, 3H), 3.66 (s, 2H), 3.73 (s, 1H), 6.93 (s, 1H), 7.00 (d, J=8.7Hz, 1H), 7.28 (d, J=8.7Hz, 1H), 7.71 (m, 4H)
II-344	2.22 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 3.31 (s, 3H), 3.65 (s, 3H), 3.66 (s, 3H), 3.73 (s, 2H), 6.98-7.48 (m, 7H)
II-345	2.23 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 3.30 (s, 3H), 3.67 (s, 2H), 3.73 (s, 3H), 6.92-7.54 (m, 7H)
II-347	2.31 (s, 3H), 3.32 (s, 3H), 3.69 (s, 2H), 3.75 (s, 1H), 7.02 (d, J=8.3Hz, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.29 (d, J=8.3Hz, 1H), 7.72 (m, 4H)
II-383	1.23 (t, J=7.5Hz, 2H), 2.27 (s, 3H), 3.63 (s, 3H), 3.63 (s, 2H), 6.89 (s, 1H), 6.96 (d, J=7.4Hz, 1H), 7.21 (d, J=7.4Hz, 1H), 7.43-7.66 (m, 3H)
II-397	2.40 (s, 3H), 3.65 (m, 3H), 3.67 (s, 2H), 6.95-7.88 (m, 4H)
II-420	1.02 (s, 9H), 2.33 (s, 2H), 3.60 (s, 2H), 3.63 (s, 3H), 5.73 (s, 1H), 6.91 (d, J=8.7Hz, 1H), 7.38 (d, J=8.7Hz, 1H), 7.42 (s, 1H)
II-427	2.46 (s, 3H), 3.11 (s, 1H), 3.50 (m, 1H), 3.66 (s, 3H), 3.66 (s, 2H), 3.66 (m, 1H), 6.98-7.31 (m, 4H)
II-520	1.48 (t, J=7.2Hz, 3H), 2.07 (s, 3H), 3.66 (s, 3H), 3.68 (s, 2H), 4.63 (q, 7.2Hz, 2H), 7.00-7.35 (m, 4H), 8.74 (s, 1H)
II-594	2.21 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 3.65 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 7.00-7.45 (m, 8H), 7.51 (s, 1H)
II-595	2.18 (s, 0.9H), 2.21 (s, 2.1H), 2.38 (s, 3H), 2.92 (d, J=4.7Hz, 0.9H), 2.98 (d, J=4.7Hz, 2.1H), 3.56 (s, 2.1H), 3.62 (s, 0.9H), 6.74 (d, J=13.2Hz, 1H), 7.00-8.10 (m, 9H)
II-596	2.28 (s, 3H), 2.45 (s, 3H), 3.48 (s, 3H), 7.20-7.55 (m, 4H), 7.68 (m, 4H)
II-597	2.19 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.64 (s, 3H), 4.75 (d, J=12Hz, 1H), 5.15 (d, J=12Hz, 1H), 6.90-7.50 (m, 7H)
II-599	2.22 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 5.33 (br, 1H), 6.93-7.52 (m, 7H)

II-600	2.28(s, 3H), 3.20(s, 3H), 3.60(s, 3H), 7.25-7.75(m, 8H)
II-601	2.28(s, 3H), 3.40(s, 3H), 3.90(s, 3H), 7.25-7.75(m, 8H)
II-604	2.08(S, 1.5H), 2.14(s, 1.5H), 2.36(s, 3H), 3.45(s, 3H), 3.66(s, 3H), 4.75(br, 1H), 5.30(br, 1H), 7.05-7.35(m, 8H)
II-607	1.20-1.60(br, 9H), 2.21(s, 3H), 2.39(s, 3H), 3.42(s, 3H), 4.65-5.29(br, 2H), 7.05-7.50(m, 8H)
III-30	3.17(s, 3H), 3.80(s, 3H), 5.85(s, 1H), 6.85-7.60(m, 8H)
III-32	3.34(s, 3H), 3.65(s, 3H), 3.75(s, 3H), 5.77(s, 1H), 6.90-7.60(m, 10H)
IV-18	2.09(s, 3H), 3.61(s, 3H), 3.64(s, 2H), 3.64(s, 3H), 6.82(s, 1H), 7.02-7.30(m, 5H)
IV-68	2.39(s, 3H), 3.65(s, 3H), 3.73(s, 2H), 4.03(s, 3H), 6.85-6.91(m, 2H), 6.91(s, 1H), 7.19-7.25(m, 1H)
IV-70	2.38(s, 3H), 3.65(s, 3H), 3.88(s, 2H), 4.03(s, 3H), 6.91(s, 1H), 6.97-6.99(m, 1H), 7.19-7.22(m, 2H)
IV-72	1.01(t, J=7.2Hz, 3H), 2.38(s, 3H), 2.39(s, 3H), 3.19(q, J=6.7Hz, 2H), 3.60(s, 2H), 4.04(s, 3H), 6.00(br, 1H), 6.92(d, J=6.4Hz, 1H), 6.91(s, 1H), 7.02(d, J=7.6Hz, 1H), 7.18(t, J=7.6Hz, 1H)
IV-83	2.40(s, 3H), 3.77(s, 3H), 4.05(s, 3H), 6.92(s, 1H), 7.02(t, J=7.6Hz, 1H), 7.11(d, J=8.0Hz, 1H), 7.16(t, J=7.6Hz, 1H), 7.47(br, 1H), 8.18(d, J=7.2Hz, 1H)
IV-90	2.92(s, 3H), 2.41(s, 3H), 3.76(s, 3H), 4.04(s, 3H), 6.92(s, 1H), 6.96(d, J=8.1Hz, 1H), 7.33(br, 1H), 8.03(d, J=8.1Hz, 1H)
IV-92	2.35(s, 0.9H), 2.38(s, 2.1H), 2.92(d, J=10.2Hz, 0.9H), 2.98(d, J=4.8Hz, 2.1H), 3.54(s, 2.1H), 3.61(s, 0.9H), 6.60-8.00(m, 7H)
IV-94	2.19(s, 3H), 2.27(s, 3H), 3.46(s, 3H), 3.64(s, 3H), 4.03(s, 3H), 4.75(d, J=12Hz, 1H), 5.12(d, J=12Hz, 1H), 6.90-7.25(m, 4H)
V-3	2.09(s, 3H), 3.64(s, 3H), 3.66(s, 2H), 3.93(s, 3H), 7.05-7.33(m, 4H)
VI-10	0.80(t, J=7.2Hz, 6H), 1.81-1.95(m, 4H), 2.19(s, 3H), 2.30(s, 3H), 3.61(s, 3H), 3.72(s, 2H), 3.85-4.00(m, 1H), 6.90-8.05(m, 5H)
VII-11	3.64(s, 3H), 3.68(s, 2H), 7.02-8.04(m, 6H), 8.83(s, 1H)
VII-16	0.95(t, J=6.8Hz, 3H), 1.37(m, 2H), 1.63(m, 2H), 2.56(s, 1H), 2.64(t, J=7.7Hz, 2H), 3.63(s, 1H), 3.68(s, 3H), 7.00-7.70(m, 6H), 8.43(s, 1H)
IX-3	3.09(s, 3H), 3.51(s, 2H), 3.61(s, 3H), 4.00(s, 2H), 7.05-7.48(m, 4H)
IX-4	1.61(d, J=7.2Hz, 3H), 3.30(s, 3H), 3.57(s, 2H), 3.62(s, 3H), 4.08(q, J=7.2Hz, 1H), 6.90-7.45(m, 4H)
IX-5	1.58(d, J=7.8Hz, 3H), 3.21(s, 3H), 3.63(s, 3H), 3.77(s, 3H), 4.05(q, J=7.8Hz, 1H), 6.85-7.40(m, 5H)
IX-14	3.38(dd, J=9.1, 11.0Hz, 1H), 3.60-3.65(m, 1H), 3.65(s, 3H), 3.66(s, 2H), 5.63(dd, J=5.8, 9.1Hz, 1H), 6.96-7.46(m, 9H)
IX-17	3.28(s, 3H), 3.64(s, 3H), 3.73(s, 2H), 6.81(s, 1H), 6.95-7.5(m, 9H)
X-10	3.03(s, 3H), 3.25(s, 2H), 3.69(s, 3H), 3.82(s, 3H), 5.71(s, 1H), 6.79-7.41(m, 10H), 7.46(s, 1H)

[試験例] 本発明に係る化合物の有用性について、以下の試験例において具体

的に説明する。但し、これらのみに限定されるものではない。

〔試験例1〕 イネいもち病防除効果試験（水面施用）

1／2万アールのピーカーポットに植えた1.5葉期のイネ（品種：日本晴）に、本発明化合物乳剤を水で希釈し500 ppmに調製した薬液を1ポット当たり10ml灌注処理した。

灌注処理7日後、処理したイネに、いもち病菌 (*Pyricularia oryzae*) の胞子懸濁液 (2×10^6 個/m³) を噴霧し接種を行った。接種を行ったイネを温度20～25℃、湿度95%以上の接種箱に一昼夜入れた。その後、温室に置き、接種7日後に形成された病斑面積の接種葉に占める割合を測定し、下記の式に従い、防除価を算出した。

$$\text{防除価} = [1 - (\text{処理区病斑面積率} / \text{無処理区病斑面積率})] \times 100$$

その結果、以下の化合物が防除価70以上を示した。

本発明化合物No. ; I-1～I-4, I-7, I-13, I-17, I-20, I-21, I-33, I-37, I-41, I-43～I-45, I-47, I-50～I-52, I-54～I-59, I-64, I-66, I-68, I-70～I-73, I-75, I-80, I-82, I-99, I-111, I-128, I-131, I-134, I-143, I-144, I-146, I-151, I-160, I-162, I-164, I-166～I-169, I-175, I-176, I-181, I-196～I-198, I-203～I-205, I-244, I-246, I-292, II-5, II-6, II-8, II-9, II-32, II-36, II-37, II-123, II-129, II-136, II-463, I-I-480, II-502, III-4, III-10～III-12, III-19, III-33, III-36, IV-55, IV-65, IV-67, IV-69, IV-74～IV-79, VII-27, VII-30, VIII-1, VIII-2, IX-2, IX-3, IX-5, X-3, XII-1

8

〔試験例2〕 イネいもち病防除効果試験（散布試験）

直径7cmのポットで育成した3葉期のイネ（品種：日本晴）に、本発明化合物乳剤を水で希釈して500 ppmに調製した薬液をスプレーガンを用いポット当たり20ml散布した。

散布翌日イネいもち病菌 (*Pyricularia oryzae*) の胞子懸濁液 (2×10^6 個/m³) を噴霧し接種を行った。接種を行ったイネを温度25℃、湿度95%以上の接種箱に一昼夜入れた。その後、温室におき、接種7日後に形成された病斑面積の接種葉に占める割合を測定し、下記の式に従い、防除

価を算出した。

$$\text{防除価} = [1 - (\text{処理区病斑面積率} / \text{無処理区病斑面積率})] \times 100$$

その結果、以下の化合物が防除価 70 以上を示した。

本発明化合物No. ; I-1～I-6, I-8～I-21, I-25～I-31, I-33, I-36～I-72, I-74, I-76, I-79, I-80, I-82, I-92～I-94, I-98～I-100, I-102, I-105～I-117, I-119, I-126～I-129, I-133, I-134, I-137, I-139～I-141, I-143～I-146, I-149, I-150, I-152, I-155, I-160～I-162, I-164～I-166, I-168, I-169, I-171, I-175, I-176, I-179, I-183, I-186, I-187, I-196～I-198, I-201, III-1～III-4, III-12, III-32, IX-10

[試験例 3] コムギうどんこ病防除効果試験

直径 5.5 cm のポットで育成した 2.0 ~ 2.5 葉期のコムギ（品種：農林 61 号）に、本発明化合物乳剤を水で希釈して 500 ppm に調整した薬液をスプレーガンを用いポット当たり 20 ml 散布した。

散布 1 日後、コムギうどんこ病菌 (*Erysiphe graminis*) の胞子を直接接種した。その後、温室に置き、接種 7 日後に形成された病斑面積の接種葉に占める割合を測定し、下記の式に従い、防除価を算出した。

$$\text{防除価} = [1 - (\text{処理区病斑面積率} / \text{無処理区病斑面積率})] \times 100$$

その結果、以下の化合物が防除価 70 以上を示した。

本発明化合物No. ; I-1, I-3～I-6, I-9～I-13, I-15, I-16, I-18, I-20～I-28, I-31, I-37, I-41, I-43, I-45, I-49, I-50, I-52, I-56, I-59, I-62, I-66～I-68, I-70, I-72, I-73, I-76, I-78～I-80, I-84～I-90, I-92～I-97, I-106, I-111, I-113, I-115, I-120, I-125, I-127, I-129, I-130, I-132, I-135, I-143, I-145～I-147, I-151, I-155, I-160, I-161, I-164, I-166, I-168, I-169, I-177, I-178, I-188, I-190, I-191, I-193～I-195, I-197, I-198, I-200, I-201, I-203, I-205～I-208, I-210～I-215, I-218～I-220, I-223～I-226, I-228, I-229, I-234, I-240, I-242～I-244, I-248, I-249, I-251～I-254, I-257, I-258, I-264～I-267, I-270～I-274, I-276～I-279, I-281, I-288～I-290, I-292～I-294, I-298～I-301, I-303, I-304, II-1～II-5, II-7～II-21, II-24～II-28, II-30～II-62, II-64～II-150, II-152～II-162, II-166～II-179, II-182～II-

187, II-189～II-191, II-193～II-210, II-212, II-213, II-215～II-258, II-260～I
 I-264, II-266, II-268～II-273, II-276, II-279～II-290, II-292～II-307, II-309,
 II-310, II-312, II-317～II-325, II-328～II-330, II-332～II-335, II-337～II-34
 2, II-346, II-348, II-350, II-352～II-363, II-365, II-366, II-368～II-373, II-37
 5, II-376, II-378, II-380～II-385, II-387～II-395, II-397～II-399, II-401, II-4
 03～II-405, II-407～II-410, II-416, II-418, II-419, II-421, II-423～II-426, II-
 428, II-430, II-433～II-435, II-439～II-441, II-448～II-456, II-459～II-461, I
 I-463, II-468～II-472, II-474～II-477, II-479～II-481, II-483～II-485, II-487
 ～II-490, II-492～II-501, II-514～II-517, II-519～II-525, II-528, II-530～II-
 533, II-535, II-551～II-553, II-555, II-557～II-559, II-563, II-565, II-567, II-
 572, II-574, II-577, II-579, II-585, II-586, II-592, II-594, III-1, III-2, III-25,
 III-26, III-30, III-33, III-35, III-38, IV-1～IV-8, IV-11～IV-17, IV-19, IV-21～
 IV-34, IV-36, IV-37, IV-40～IV-53, IV-55～IV-58, IV-60～IV-62, IV-64～IV-66, IV
 -68～IV-70, IV-75～IV-79, IV-83, IV-84, IV-87, IV-89～IV-91, IV-93, V-1～V-9, V-
 11, V-15～V-17, V-20, V-22～V-26, VI-2, VI-4～VI-8, VI-11, VI-12, VI-14～VI-17, V
 I-24, VII-1～VII-10, VII-12～VII-21, VII-23～VII-27, VII-30, VII-34, VII-37, VI
 I-38, VII-40, VII-42, VII-50, VIII-1, IX-1, IX-2, IX-5, IX-7, IX-14, IX-19～IX-21,
 XI-1, XI-3, XII-7, XII-1～XII-14, XII-16, XII-18, XII-22～XII-24, XII-29

〔試験例4〕 コムギ赤さび病防除効果試験

直径5.5 cmのポットで育成した2.0～2.5葉期のコムギ（品種：農林61号）に、本発明化合物乳剤を水で希釈して500 ppmに調整した薬液をスプレーガンを用いポット当たり20 ml散布した。

散布1日後、コムギ赤さび病菌 (*Puccinia recondita*) の胞子懸濁液 (2×10^6 個/m³) を噴霧し、温度20～25℃、湿度95%以上の接種箱に一昼夜入れた。その後、温室に置き、接種10日後に形成された病斑面積を測定し、下記の式に従い、防除価を算出した。

$$\text{防除価} = [1 - (\text{処理区病斑面積率} / \text{無処理区病斑面積率})] \times 100$$

その結果、以下の化合物が防除価70以上を示した。

本発明化合物No. ; I-1～I-16, I-18～I-21, I-24～I-31, I-33, I-35～I-57, I-59, I-60, I-62～I-74, I-76～I-80, I-82～I-89, I-91～I-100, I-102, I-104～I-112, I-114～I-121, I-123～I-137, I-139, I-143～I-149, I-151～I-153, I-155, I-160～I-168, I-170, I-171, I-173～I-183, I-187～I-191, I-193～I-200, I-203, I-205～I-209, I-211, I-212, I-214～I-221, I-223～I-230, I-232～I-234, I-236, I-238～I-276, I-278～I-290, I-292～I-305, II-1～II-62, II-64～II-150, II-152～II-163, II-164～II-197, II-199～II-213, II-215～II-266, II-268～II-274, II-276, II-279～II-310, II-313, II-315～II-333, II-335～II-346, II-348～II-351, II-353～II-366, I-I-368～II-373, II-375～II-402, II-404～II-410, II-413～II-419, II-421～II-426, II-428～II-436, II-438～II-441, II-448～II-457, II-459～II-461, II-463～I-466, II-468～II-482, II-484～II-506, II-508～II-511, II-514～II-533, II-535, I-I-538～II-540, II-542, II-544, II-549～II-555, II-557～II-560, II-563, II-565～II-568, II-570, II-572, II-574, II-577, II-579, II-585, II-586, II-592, II-594, III-1, III-2, III-4, III-5, III-12, III-16～III-18, III-22, III-23, III-25, III-26, III-28～III-30, III-33, III-35, III-37, III-38, III-41, III-43, IV-1～IV-66, IV-68～IV-79, IV-81, IV-83～IV-85, IV-87, IV-89～IV-91, IV-93, V-1～V-12, V-14～V-26, VI-1～VI-24, VII-1～VII-10, VII-12～VII-27, VII-30～VII-38, VII-40～VII-43, VII-45, VII-47, VII-50, VII-51, VII-53, VIII-1, VIII-2, IX-6, IX-14, IX-19～IX-21, X-10, XI-1～XI-3, XI-5, XI-7, XII-1～XII-7, XII-9～XII-16, XII-18, XII-19, XII-23～XII-26, XII-29

〔試験例5〕 コムギふ枯れ病防除試験

直径5.5cmのポットで育成した2.0～2.5葉期のコムギ（品種：アルトリア）に、本発明化合物の乳剤を水で希釀して500ppmに調製した薬液をスプレーガンを用いポットあたり20ml散布処理した。

散布1日後、ふ枯れ病菌 (*Leptosphaera nodorum*) の胞子懸濁液 (2×10^6 個/m³) を噴霧し接種を行った。接種を行ったコムギを温度18～20℃、湿度95%以上の接種箱に7～10日間入れ発病を促進させた。形成された病斑面積の接種葉に占める割合を測定し、下記の式に従い、防除価を算出した。

防除率 = [1 - (処理区病斑面積率 / 無処理区病斑面積率)] × 100

その結果、以下の化合物が防除率 70 以上を示した。

本発明化合物 N o . ; I-1~I-28, I-31, I-33, I-34, I-36, I-37, I-39~I-50, I-52, I-54~I-71, I-73~I-76, I-78~I-80, I-82~I-91, I-93, I-96, I-97, I-99, I-100, I-102, I-103, I-105~I-110, I-112~I-121, I-123, I-125~I-130, I-132~I-137, I-143, I-145~I-147, I-149, I-150, I-153, I-155, I-160~I-162, I-164~I-170, I-172, I-174, I-175, I-177, I-179, I-182, I-183, I-187~I-191, I-193~I-195, I-197~I-201, I-203~I-212, I-215~I-221, I-223~I-226, I-228~I-236, I-239~I-254, I-256~I-258, I-260, I-261, I-264~I-279, I-281~I-283, I-286, I-287, I-289, I-290, I-292~I-296, I-299~I-304, II-1~II-45, II-47~II-62, II-64~II-106, II-108~I-150, II-152~II-162, II-164~II-187, II-189~II-213, II-215~II-258, II-260, II-262~II-264, II-266, II-268~II-274, II-276, II-279~II-310, II-313, II-317~II-325, II-328~II-342, II-346, II-348~II-366, II-368~II-395, II-397~II-399, II-401, II-403~II-410, II-413~II-419, II-421~II-430, II-432~II-434, II-436, II-438~II-441, II-448~II-452, II-454~II-461, II-463~II-466, II-468~II-482, II-484~II-506, II-508~II-511, II-514~II-533, II-535~II-543, II-548~II-555, II-557~II-559, II-563, II-565~II-569, II-571~II-577, II-579, II-583~II-587, II-590, II-592, II-594, II-595, III-1~III-5, III-12, III-14, II-16, III-19, III-22, III-23, III-25, III-26, III-28~III-30, III-32, III-33, III-35, III-37, III-38, III-41, IV-1, IV-2, IV-4~IV-38, IV-40~IV-53, IV-55~IV-58, IV-60~IV-79, IV-81, IV-83~IV-85, IV-87, IV-89~IV-93, V-1~V-13, V-15~V-18, V-21, V-23~V-26, VI-1~VI-24, VII-1~VII-10, VII-12~VII-28, VII-30~VII-43, VII-45, VII-47, VII-50, VII-51, VII-53, VIII-1, VIII-2, IX-1, IX-5, IX-14, IX-15, IX-19~IX-21, X-6, X-7, XI-1~XI-5, XI-7, XII-2~XII-16, XII-18, XII-19, XII-29

[試験例 6] キュウリベと病防除効果試験

直径 7 cm のポットで育成した 1.5 葉期のキュウリ（品種：相模半白）に、本発明化合物乳剤を水で希釈して 500 ppm に調製した薬液をスプレーガンを用いポット当たり 20 ml 敷布した。

散布 1 日後、キュウリベと病菌 (*Pseudoperonospora cubensis*) の胞子懸濁液 (2×10^5 個/m³) を噴霧し、温度 20~25 ℃、湿度 95% 以上の接種箱に一昼夜入れた。その後、温室におき、接種 7 日後に形成された病斑面積の接種葉に占める割合を測定し、下記の式に従い、防除価を算出した。

$$\text{防除価} = [1 - (\text{処理区病斑面積率} / \text{無処理区病斑面積率})] \times 100$$

その結果、以下の化合物が防除価 70 以上を示した。

本発明化合物 No. ; I-1, I-3, I-6, I-9~I-13, I-16~I-21, I-23, I-25, I-28, I-33, I-37, I-38, I-43~I-49, I-51~I-57, I-59, I-62, I-64~I-66, I-68, I-70~I-72, I-74, I-76, I-80, I-81, I-87, I-89, I-91, I-92, I-102, I-107, I-109~I-111, I-113~I-115, I-117~I-120, I-125, I-127~I-129, I-131, I-133~I-137, I-139, I-140, I-144, I-145, I-147, I-149, I-155, I-161~I-169, I-171~I-173, I-175~I-179, I-181, I-183, I-187~I-191, I-194, I-195, I-197, I-198, I-200, I-208, I-211, I-217~I-220, I-223, I-225, I-228, I-229, I-232, I-236, I-239~I-241, I-244, I-245, I-247, I-248, I-252, I-253, I-258, I-264, I-268, I-270, I-274~I-276, I-292~I-295, II-2, II-4~II-16, II-18~II-22, II-24, II-28~II-31, II-33, II-35, II-38, II-41~II-43, II-47, II-48, II-53, II-55~II-57, II-59~II-61, II-65~II-73, II-75, II-79, II-83, II-84, II-89, II-90, II-92, II-94~II-96, II-98~II-101, II-106, II-111, II-114, II-119, II-121, II-123, II-125, II-127~II-135, II-137, II-139~II-149, II-153, II-155~II-161, II-165, II-169~II-172, II-174, II-175, II-177, II-179, II-180, II-182, II-183, II-186, II-189, II-191, II-193, II-195, II-196, II-198, II-200, II-201, II-203, II-205~II-213, II-215~II-217, II-219, II-221~II-244, II-246~II-252, II-255~II-258, II-260, II-262, II-266, II-268, II-270, II-271, II-273, II-274, II-276, II-279~II-290, II-292~II-297, II-299~II-305, II-307~II-310, II-313, II-317~II-319, II-321, II-324, II-325, II-328~II-333, II-337~II-339, II-341, II-342, II-346, II-348~II-351, II-354, II-356~II-365, II-368, II-372, II-373, II-375, II-376, II-378, II-380~II-391, II-393, II-394, II-398, II-399, II-404, II-405, II-407~II-411, II-414, II-415, II-417, II-419, II-421, II-

424～II-426, II-428, II-434～II-441, II-448～II-454, II-456, II-457, II-459, II-460, II-463, II-471, II-474, II-475, II-477～II-481, II-484, II-485, II-487～II-494, II-496～II-502, II-504, II-506, II-508, II-509, II-511, II-512, II-514～II-521, II-523～II-538, II-540, II-542, II-543, II-545, II-548～II-559, II-563, II-565～II-568, III-2, III-35, III-43, IV-1～IV-5, IV-7, IV-8, IV-11～IV-16, IV-19～IV-23, IV-25～IV-36, IV-38, IV-41～IV-45, IV-47～IV-49, IV-51, IV-52, IV-55～IV-57, IV-60～IV-65, IV-69, IV-72, IV-74～IV-79, IV-81, IV-83～IV-85, V-1, V-2, V-6, V-7, V-9, V-15～V-17, V-21, V-22, VI-1, VI-2, VI-4～VI-6, VI-8～VI-15, VII-1～VII-9, VII-14～VII-27, VII-30～VII-34, VII-36～VII-38, VII-40～VII-43, VII-45～VII-47, VIII-1, VIII-2IX-2, IX-18, IX-19, XI-3, XII-2, XII-25

〔試験例7〕 トビイロウンカに対する殺虫試験

本発明化合物の5%乳剤（化合物によって25%水和剤を供試）を展着剤の入った水で希釈して、500 ppm濃度の薬液に調製した。

この薬液を1/20,000アールのポットに植えたイネの茎葉に十分量散布した。風乾後、円筒をたて、トビイロウンカの2令幼虫をポット当たり、10頭放虫し、蓋をし、恒温室に保管した。調査は6日経過後に行い死虫率を下記の計算式から求めた。尚、試験は2区制で行なった。

$$\text{死虫率} (\%) = [\text{死虫数} / (\text{死虫数} + \text{生存虫数})] \times 100$$

その結果、以下の化合物が70%以上の死虫率を示した。

本発明化合物No. ; I-50, I-184, I-270, I-275, I-276, I-277, II-65, II-67, II-81, II-98, II-131, II-155, II-158, II-182, II-183, II-186, II-189, II-191, VII-6

〔試験例8〕 ツマグロヨコバイに対する殺虫試験

本発明化合物の500 ppm濃度の乳化液中に稻の茎葉を約10秒間浸漬し、この茎葉をガラス円筒に入れ、有機リン系殺虫剤に抵抗性を示すツマグロヨコバイ成虫を放ち、孔のあいた蓋をして25℃の恒温室に収容し、6日後の死虫数を調査し、試験例7と同様の計算式から死虫率を求めた。尚、試験は2区制でおこなった。その結果、以下の化合物が70%以上の死虫率を示した。

本発明化合物No. ; I-10, I-11, I-16, I-37, I-45, I-47, I-50, I-52, I-54, I-55,

I-68, I-72, I-83, I-88, I-89, I-91, I-109, I-113, I-137, I-160, I-162, I-166, I-168, I-197, I-256, I-257, I-258, I-269, I-270, I-275, I-290, I-292, II-55, II-65, II-81, II-84, II-91, II-98, II-106, II-114, II-125, II-131, II-132, II-153, II-155, II-157~II-160, II-175, II-177, II-179, II-182, II-183, II-186, II-189, II-191, II-193, II-198, II-206~II-208, II-210, II-213, II-215~II-217, II-219, II-463, III-5, VII-6, IX-12

〔試験例 9〕コナガに対する接触性殺虫試験

本発明化合物の 500 ppm 濃度の水乳化液中にカンランの葉を約 10 秒間浸漬し、風乾後シャーレに入れ、この中にコナガ 2 令幼虫をシャーレ当たり 10 頭ずつ放ち、孔のあいた蓋をして 25 ℃ の恒温室に収容し、6 日後の死虫数を調査し、試験例 7 と同様の計算式から死虫率を求めた。尚、試験は 2 区制でおこなった。その結果、以下の化合物が 70 % 以上の死虫率を示した。

本発明化合物 N o. ; I-37, I-47, I-50, I-52, I-54, I-55, I-63, I-88, I-89, I-96, I-109, I-113, I-119, I-125, I-129, I-137, I-203, I-208, I-220, I-257, I-258, I-270, I-275, I-276, I-277, I-279, I-281, II-55, II-67, II-91, II-113, II-114, II-121, II-125, II-127, II-130~II-132, II-143, II-147, II-149, II-153, II-158, II-160, II-169, II-177, II-182, II-183, II-189, II-195, II-196, II-201, II-207, II-213, II-215, II-217, II-382, II-383, II-387, II-389~II-391, VII-3, VII-4, VII-6, VII-7

〔試験例 10〕ナミハダニに対する殺ダニ効力試験

インゲンの葉をリーフパンチを用いて径 3.0 cm の円形に切り取り、径 7 cm のスチロールカップ上の湿った濾紙上に置いた。これにナミハダニ幼虫を 1 葉当たり 10 頭接種した。明細書に記載された本発明化合物の 5 % 乳剤（化合物によっては 25 % 水和剤を供試）を展着剤の入った水で希釈して、500 ppm 濃度の薬液に調整しこの薬液をスチロールカップ当たり 2 ml ずつ回転式散布塔を用いて散布し、25 ℃ の恒温室に収容し、96 時間経過後の死虫率を試験例 7 と同様の計算式から求めた。尚、試験は 2 区制で行なった。その結果、以下の化合物が 70 % 以上の死虫率を示した。

本発明化合物 N o. ; I-37, I-45, I-47, I-50, I-52, I-54, I-55, I-64, I-95, I-105, I-109, I-111, I-113, I-115, I-117, I-125, I-126, I-127, I-128, I-129, I-131, I-133, I

-137, I-139, I-161, I-162, I-164, I-165, I-166, I-167, I-168, I-169, I-289, I-290, I-294, II-91, II-106, II-111, II-114, II-120, II-121, II-123, II-125, II-128, II-131, II-132, II-143, II-144, II-147~II-150, II-153, II-155, II-157, II-158, II-160, II-174, II-175, II-180, II-183, II-189, II-191, II-195, II-196, II-202, II-206, I-210, II-213, II-217, II-382, II-383, II-387, II-389~II-391, VII-3, VII-4, VII-6, VII-7

〔試験例 1 1〕 ハスモンヨトウに対する殺虫効力試験

本発明化合物の 10 % 乳剤（化合物によっては 25 % 水和剤を供試）を展着剤の入った水で希釀して、500 ppm 濃度の薬液を調製した。この薬液中にカンランの葉を約 10 秒間浸漬し、風乾後シャーレに入れ、この中にハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*) の 2 齢幼虫をシャーレ当たり 10 頭放虫し、孔の開いた蓋をして 25 ℃ 恒温室に収容した。6 日後の死虫数を試験例 7 と同様の計算式から求めた。尚、試験は 2 区制で行なった。その結果、以下の化合物が 70 % の死虫率を示した。

本発明化合物 N o. ; I-270, I-275, I-276, II-113, II-130, II-131, II-149, II-177, II-183, II-189, II-207, II-213, II-215, II-217, II-382, II-383, II-389, II-391

〔試験例 1 2〕 モモアカアブラムシに対する殺虫効力試験

内径 3 cm のガラスシャーレに湿った滤紙を敷き、その上に同径のキャベツの葉を置いた。モモアカアブラムシ無翅雌成虫を 4 頭放ち、1 日後に回転式散布塔にて薬液を散布（2.5 mg/cm²）した。薬液は、明細書に記載された本発明化合物の 5 % 乳剤（化合物によっては 25 % 水和剤を供試）を展着剤の入った水で希釀して 500 ppm 濃度に調整したものを用いた。処理 6 日後に成虫および幼虫の死虫率を試験例 7 と同様の計算式から求めた。なお試験は 2 区制で行なった。その結果、以下の化合物が 70 % の死虫率を示した。

本発明化合物 N o. ; I-16, I-88, I-96, I-223, I-253, I-256, I-257, I-258, I-269, I-270, I-273, I-275, I-276, I-293, II-1, II-2, II-4, II-7, II-8, II-10, II-11, II-16, II-18, II-21, II-41, II-42, II-46~II-48, II-55, II-57, II-65, II-67, II-69, II-70, II-72, II-73, II-75, II-79, II-81~II-84, II-89~II-92, II-94, II-96, II-98, II-100, II-101, II-106, II-114, II-123, II-125, II-129~II-132, II-137, II-139, II-1

40, II-147, II-149, II-155, II-157, II-158, I-160, II-169, II-171, II-172, II-174, II-175, II-177, II-179, II-181, II-184, II-186, II-189, II-191, II-193, II-195, II-196, II-198, II-199, II-201, II-203～II-209, II-213, II-215, II-216, II-218, II-463VII-3, VII-4, VII-6

〔試験例〕 本発明に係る化合物の有用性について、以下の試験例において具体的に説明する。但し、これらのみに限定されるものではない。

〔試験例 1〕 イネいもち病防除効果試験（水面施用）

1／2万アールのビーカーポットに植えた1.5葉期のイネ（品種：日本晴）に、本発明化合物乳剤を水で希釈し500 ppmに調製した薬液を1ポット当たり10ml灌注処理した。

灌注処理7日後、処理したイネに、いもち病菌 (*Pyricularia oryzae*) の胞子懸濁液 (2×10^5 個/m³) を噴霧し接種を行った。接種を行ったイネを温度20～25℃、湿度95%以上の接種箱に一昼夜入れた。その後、温室に置き、接種7日後に形成された病斑面積の接種葉に占める割合を測定し、下記の式に従い、防除率を算出した。

$$\text{防除率} = [1 - (\text{処理区病斑面積率} / \text{無処理区病斑面積率})] \times 100$$

その結果、以下の化合物が防除率70以上を示した。

本発明化合物N〇. ;I-1, I-2, I-3, I-4, I-7, I-13, I-17, I-20, I-21, I-33, I-37, I-41, I-43, I-44, I-45, I-47, I-50, I-51, I-52, I-54, I-55, I-56, I-57, I-58, I-59, I-64, I-66, I-68, I-70, I-71, I-72, I-73, I-75, I-80, I-82, I-99, I-111, I-128, I-131, I-134, I-143, I-144, I-146, I-151, I-160, I-162, I-164, I-166, I-167, I-168, I-169, I-175, I-176, I-181, I-196, I-197, I-198, I-203, I-204, I-205, I-244, I-246, I-292, II-5, II-6, II-8, II-9, II-32, II-36, II-37, II-123, II-129, II-136, II-463, II-480, II-502, III-4, III-10, III-11, III-12, III-19, III-33, III-36, IV-55, IV-65, IV-67, IV-69, IV-74, IV-75, IV-76, IV-77, IV-78, IV-79, VII-27, VII-30, VIII-1, VIII-2IX-2, IX-3, IX-5, X-3, XII-18

〔試験例 2〕 イネいもち病防除効果試験（散布試験）

直径7cmのポットで育成した3葉期のイネ（品種：日本晴）に、本発明化合物乳剤を水で希釈して500 ppmに調製した薬液をスプレーガンを用いポット

当たり 20 m¹ 散布した。

散布翌日イネいもち病菌 (*Pyricularia oryzae*) の胞子懸濁液 (2×10^5 個/m¹) を噴霧し接種を行った。接種を行ったイネを温度 25 ℃、湿度 95 %以上の接種箱に一昼夜入れた。その後、温室におき、接種 7 日後に形成された病斑面積の接種葉に占める割合を測定し、下記の式に従い、防除価を算出した。

$$\text{防除価} = [1 - (\text{処理区病斑面積率} / \text{無処理区病斑面積率})] \times 100$$

その結果、以下の化合物が防除価 70 以上を示した。

本発明化合物 N o. ; I-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-6, I-8, I-9, I-10, I-11, I-12, I-13, I-14, I-15, I-16, I-17, I-18, I-19, I-20, I-21, I-25, I-26, I-27, I-28, I-29, I-30, I-31, I-33, I-36, I-37, I-38, I-39, I-40, I-41, I-42, I-43, I-44, I-45, I-46, I-47, I-48, I-49, I-50, I-51, I-52, I-53, I-54, I-55, I-56, I-57, I-58, I-59, I-60, I-61, I-62, I-63, I-64, I-65, I-66, I-67, I-68, I-69, I-70, I-71, I-72, I-74, I-76, I-79, I-80, I-82, I-92, I-93, I-94, I-98, I-99, I-100, I-102, I-105, I-106, I-107, I-108, I-109, I-110, I-111, I-112, I-113, I-114, I-115, I-116, I-117, I-119, I-126, I-127, I-128, I-129, I-133, I-134, I-137, I-139, I-140, I-141, I-143, I-144, I-145, I-146, I-149, I-150, I-152, I-155, I-160, I-161, I-162, I-164, I-165, I-166, I-168, I-169, I-171, I-175, I-176, I-179, I-183, I-186, I-187, I-196, I-197, I-198, I-201, III-1, III-2, III-3, III-4, III-12, III-32, IX-10

[試験例 3] コムギうどんこ病防除効果試験

直径 5.5 cm のポットで育成した 2.0 ~ 2.5 葉期のコムギ (品種: 農林 61 号) に、本発明化合物乳剤を水で希釈して 500 ppm に調整した薬液をスプレーガンを用いポット当たり 20 m¹ 散布した。

散布 1 日後、コムギうどんこ病菌 (*Erysiphe graminis*) の胞子を直接接種した。その後、温室に置き、接種 7 日後に形成された病斑面積の接種葉に占める割合を測定し、下記の式に従い、防除価を算出した。

$$\text{防除価} = [1 - (\text{処理区病斑面積率} / \text{無処理区病斑面積率})] \times 100$$

その結果、以下の化合物が防除価 70 以上を示した。

本発明化合物 N o. ; I-1, I-3, I-4, I-5, I-6, I-9, I-10, I-11, I-12, I-13, I-15, I-1

6, I-18, I-20, I-21, I-22, I-23, I-24, I-25, I-26, I-27, I-28, I-31, I-37, I-41, I-43, I-45, I-49, I-50, I-52, I-56, I-59, I-62, I-66, I-67, I-68, I-70, I-72, I-73, I-76, I-78, I-79, I-80, I-84, I-85, I-86, I-87, I-88, I-89, I-90, I-92, I-93, I-94, I-95, I-96, I-97, I-106, I-111, I-113, I-115, I-120, I-125, I-127, I-129, I-130, I-132, I-135, I-143, I-145, I-146, I-147, I-151, I-155, I-160, I-161, I-164, I-166, I-168, I-169, I-177, I-178, I-188, I-190, I-191, I-193, I-194, I-195, I-197, I-198, I-200, I-201, I-203, I-205, I-206, I-207, I-208, I-210, I-211, I-212, I-213, I-214, I-215, I-218, I-219, I-220, I-223, I-224, I-225, I-226, I-228, I-229, I-234, I-240, I-242, I-243, I-244, I-248, I-249, I-251, I-252, I-253, I-254, I-257, I-258, I-264, I-265, I-266, I-267, I-270, I-271, I-272, I-273, I-274, I-276, I-277, I-278, I-279, I-281, I-288, I-289, I-290, I-292, I-293, I-294, I-298, I-299, I-300, I-301, I-303, I-304, III-1, III-2, III-25, III-26, III-30, III-33, III-35, III-38, IX-1, IX-2, IX-5, IX-7, IX-14, IX-19, IX-20, IX-21, XI-1, XI-3, XI-7, XII-1, XII-2, XII-3, XII-4, XII-5, XII-6, XII-8, XII-7, XII-9, XII-10, XII-11, XII-12, XII-13, XII-14, XII-16, XII-18, XII-22, XII-23, XII-24, XII-29

〔試験例 4〕 コムギ赤さび病防除効果試験

直径 5. 5 cm のポットで育成した 2. 0 ~ 2. 5 葉期のコムギ（品種：農林 61 号）に、本発明化合物乳剤を水で希釈して 500 ppm に調整した薬液をスプレーガンを用いポット当たり 20 ml 敷布した。

散布 1 日後、コムギ赤さび病菌 (*Puccinia recondita*) の胞子懸濁液 (2×10^5 個 / m l) を噴霧し、温度 20 ~ 25°C、湿度 95 % 以上の接種箱に一昼夜入れた。その後、温室に置き、接種 10 日後に形成された病斑面積を測定し、下記の式に従い、防除価を算出した。

$$\text{防除価} = [1 - (\text{処理区病斑面積率} / \text{無処理区病斑面積率})] \times 100$$

その結果、以下の化合物が防除価 70 以上を示した。

本発明化合物 N o. ; I-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-6, I-7, I-8, I-9, I-10, I-11, I-12, I-13, I-14, I-15, I-16, I-18, I-19, I-20, I-21, I-24, I-25, I-26, I-27, I-28, I-29, I-30, I-31, I-33, I-35, I-36, I-37, I-38, I-39, I-40, I-41, I-42, I-43, I-44, I-45, I-46, I-47, I-48, I-49, I-50, I-51, I-52, I-53, I-54, I-55, I-56, I-57, I-59, I-60, I-62, I-

63, I-64, I-65, I-66, I-67, I-68, I-69, I-70, I-71, I-72, I-73, I-74, I-76, I-77, I-78, I-79, I-80, I-82, I-83, I-84, I-85, I-86, I-87, I-88, I-89, I-91, I-92, I-93, I-94, I-95, I-96, I-97, I-98, I-99, I-100, I-102, I-104, I-105, I-106, I-107, I-108, I-109, I-110, I-111, I-112, I-114, I-115, I-116, I-117, I-118, I-119, I-120, I-121, I-123, I-124, I-125, I-126, I-127, I-128, I-129, I-130, I-131, I-132, I-133, I-134, I-135, I-136, I-137, I-139, I-143, I-144, I-145, I-146, I-147, I-148, I-149, I-151, I-152, I-153, I-155, I-160, I-161, I-162, I-163, I-164, I-165, I-166, I-167, I-168, I-170, I-171, I-173, I-174, I-175, I-176, I-177, I-178, I-179, I-180, I-181, I-182, I-183, I-187, I-188, I-189, I-190, I-191, I-193, I-194, I-195, I-196, I-197, I-198, I-199, I-200, I-203, I-205, I-206, I-207, I-208, I-209, I-211, I-212, I-214, I-215, I-216, I-217, I-218, I-219, I-220, I-221, I-223, I-224, I-225, I-226, I-227, I-228, I-229, I-230, I-232, I-233, I-234, I-236, I-238, I-239, I-240, I-241, I-242, I-243, I-244, I-245, I-246, I-247, I-248, I-249, I-250, I-251, I-252, I-253, I-254, I-255, I-256, I-257, I-258, I-259, I-260, I-261, I-262, I-263, I-264, I-265, I-266, I-267, I-268, I-269, I-270, I-271, I-272, I-273, I-274, I-275, I-276, I-278, I-279, I-280, I-281, I-282, I-283, I-284, I-285, I-286, I-287, I-288, I-289, I-290, I-292, I-293, I-294, I-295, I-296, I-297, I-298, I-299, I-300, I-301, I-302, I-303, I-304, I-305, III-1, III-2, III-4, III-5, III-12, III-16, III-17, III-18, III-22, III-23, III-25, III-26, III-28, III-29, III-30, III-33, III-35, III-37, III-38, III-41, III-43, IV-6, IV-14, IV-19, IV-20, IV-21, X-10, XI-1, XI-2, XI-3, XI-5, XI-7, XII-1, XII-2, XII-3, XI-I-4, XII-5, XII-6, XII-7, XII-9, XII-10, XII-11, XII-12, XII-13, XII-14, XII-15, XI-I-16, XII-18, XII-19, XII-23, XII-24, XII-25, XII-26, XII-29

[試験例 5] コムギふ枯れ病防除試験

直径 5. 5 cm のポットで育成した 2. 0 ~ 2. 5 葉期のコムギ（品種：アルトリア）に、本発明化合物の乳剤を水で希釈して 500 ppm に調製した薬液をスプレーガンを用いポットあたり 20 ml 敷布処理した。

散布 1 日後、ふ枯れ病菌 (*Leptosphaera nodorum*) の胞子懸濁液 (2×10^5 個 / m l) を噴霧し接種を行った。接種を行ったコムギを温度 18 ~ 20 °C、湿度 95 % 以上の接種箱に 7 ~ 10 日間入れ発病を促進させ

た。形成された病斑面積の接種葉に占める割合を測定し、下記の式に従い、防除価を算出した。

$$\text{防除価} = [1 - (\text{処理区病斑面積率} / \text{無処理区病斑面積率})] \times 100$$

その結果、以下の化合物が防除価 70 以上を示した。

本発明化合物No. ; I-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-6, I-7, I-8, I-9, I-10, I-11, I-12, I-13, I-14, I-15, I-16, I-17, I-18, I-19, I-20, I-21, I-22, I-23, I-24, I-25, I-26, I-27, I-28, I-31, I-33, I-34, I-36, I-37, I-39, I-40, I-41, I-42, I-43, I-44, I-45, I-46, I-47, I-48, I-49, I-50, I-52, I-54, I-55, I-56, I-57, I-58, I-59, I-60, I-61, I-62, I-63, I-64, I-65, I-66, I-67, I-68, I-69, I-70, I-71, I-73, I-74, I-75, I-76, I-78, I-79, I-80, I-82, I-83, I-84, I-85, I-86, I-87, I-88, I-89, I-90, I-91, I-93, I-96, I-97, I-99, I-100, I-102, I-103, I-105, I-106, I-107, I-108, I-109, I-110, I-112, I-113, I-114, I-115, I-116, I-117, I-118, I-119, I-120, I-121, I-123, I-125, I-126, I-127, I-128, I-129, I-130, I-132, I-133, I-134, I-135, I-136, I-137, I-143, I-145, I-146, I-147, I-149, I-150, I-153, I-155, I-160, I-161, I-162, I-164, I-165, I-166, I-167, I-168, I-169, I-170, I-172, I-174, I-175, I-177, I-179, I-182, I-183, I-187, I-188, I-189, I-190, I-191, I-193, I-194, I-195, I-197, I-198, I-199, I-200, I-201, I-203, I-204, I-205, I-206, I-207, I-208, I-209, I-210, I-211, I-212, I-215, I-216, I-217, I-218, I-219, I-220, I-221, I-223, I-224, I-225, I-226, I-228, I-229, I-230, I-231, I-232, I-233, I-234, I-235, I-236, I-239, I-240, I-241, I-242, I-243, I-244, I-245, I-246, I-247, I-248, I-249, I-250, I-251, I-252, I-253, I-254, I-256, I-257, I-258, I-260, I-261, I-264, I-265, I-266, I-267, I-268, I-269, I-270, I-271, I-272, I-273, I-274, I-275, I-276, I-277, I-278, I-279, I-281, I-282, I-283, I-286, I-287, I-289, I-290, I-292, I-293, I-294, I-295, I-296, I-299, I-300, I-301, I-302, I-303, I-304, II-I-1, III-2, III-3, III-4, III-5, III-12, III-14, III-16, III-19, III-22, III-23, II-I-25, III-26, III-28, III-29, III-30, III-32, III-33, III-35, III-37, III-38, III-41, IV-1, IV-5, IV-14, IV-15, IV-19, IV-20, IV-21, X-6, X-7, XI-1, XI-2, XI-3, XI-4, X-I-5, XI-7, XII-2, XII-3, XII-4, XII-5, XII-6, XII-7, XII-8, XII-9, XII-10, XII-11, XII-12, XII-13, XII-14, XII-15, XII-16, XII-18, XII-19, XII-29

〔試験例 6〕 キュウリべと病防除効果試験

直径 7 cm のポットで育成した 1. 5 葉期のキュウリ（品種：相模半白）に、本発明化合物乳剤を水で希釈して 500 ppm に調製した薬液をスプレーガンを用いポット当たり 20 ml 敷布した。

散布 1 日後、キュウリベと病菌 (*Pseudoperonospora cubensis*) の胞子懸濁液 (2×10^5 個/m³) を噴霧し、温度 20 ~ 25 °C、湿度 95 % 以上の接種箱に一昼夜入れた。その後、温室におき、接種 7 日後に形成された病斑面積の接種葉に占める割合を測定し、下記の式に従い、防除価を算出した。

$$\text{防除価} = [1 - (\text{処理区病斑面積率} / \text{無処理区病斑面積率})] \times 100$$

その結果、以下の化合物が防除価 70 以上を示した。

本発明化合物 N o. ; I-1, I-3, I-6, I-9, I-10, I-11, I-12, I-13, I-16, I-17, I-18, I-19, I-20, I-21, I-23, I-25, I-28, I-33, I-37, I-38, I-43, I-44, I-45, I-46, I-47, I-48, I-49, I-51, I-52, I-53, I-54, I-55, I-56, I-57, I-59, I-62, I-64, I-65, I-66, I-68, I-70, I-71, I-72, I-74, I-76, I-80, I-81, I-87, I-89, I-91, I-92, I-102, I-107, I-109, I-110, I-111, I-113, I-114, I-115, I-117, I-118, I-119, I-120, I-125, I-127, I-128, I-129, I-131, I-133, I-134, I-135, I-136, I-137, I-139, I-140, I-144, I-145, I-147, I-149, I-155, I-161, I-162, I-163, I-164, I-165, I-166, I-167, I-168, I-169, I-171, I-172, I-173, I-175, I-176, I-177, I-178, I-179, I-181, I-183, I-187, I-188, I-189, I-190, I-191, I-194, I-195, I-197, I-198, I-200, I-208, I-211, I-217, I-218, I-219, I-220, I-223, I-225, I-228, I-229, I-232, I-236, I-239, I-240, I-241, I-244, I-245, I-247, I-248, I-252, I-253, I-258, I-264, I-268, I-270, I-274, I-275, I-276, I-292, I-293, I-294, I-295, III-2, III-35, III-43, IV-2, IV-18, IV-19, XI-3, XII-2, XIII-25

[試験例 7] トビイロウンカに対する殺虫試験

本発明化合物の 5 % 乳剤（化合物によって 25 % 水和剤を供試）を展着剤の入った水で希釈して、500 ppm 濃度の薬液に調製した。

この薬液を 1/20, 000 アールのポットに植えたイネの茎葉に十分量散布した。風乾後、円筒をたて、トビイロウンカの 2 令幼虫をポット当たり、10 頭放虫し、蓋をし、恒温室に保管した。調査は 6 日経過後に行い死虫率を下記の計

算式から求めた。尚、試験は2区制で行なった。

$$\text{死虫率（%）} = [\text{死虫数} / (\text{死虫数} + \text{生存虫数})] \times 100$$

その結果、以下の化合物が70%以上の死虫率を示した。

本発明化合物No. ; I-50, I-184, I-270, I-275, I-276, I-277

〔試験例8〕 ツマグロヨコバイに対する殺虫試験

本発明化合物の500 ppm濃度の乳化液中に稻の茎葉を約10秒間浸漬し、この茎葉をガラス円筒に入れ、有機リン系殺虫剤に抵抗性を示すツマグロヨコバイ成虫を放ち、孔のあいた蓋をして25℃の恒温室に収容し、6日後の死虫数を調査し、試験例7と同様の計算式から死虫率を求めた。尚、試験は2区制でおこなった。その結果、以下の化合物が70%以上の死虫率を示した。

本発明化合物No. ; I-10, I-11, I-16, I-37, I-45, I-47, I-50, I-52, I-54, I-55, I-68, I-72, I-83, I-88, I-89, I-91, I-109, I-113, I-137, I-160, I-162, I-166, I-168, I-197, I-256, I-257, I-258, I-269, I-270, I-275, I-290, I-292, III-5, IV-12

〔試験例9〕 コナガに対する接触性殺虫試験

本発明化合物の500 ppm濃度の水乳化液中にカンランの葉を約10秒間浸漬し、風乾後シャーレに入れ、この中にコナガ2令幼虫をシャーレ当たり10頭ずつ放ち、孔のあいた蓋をして25℃の恒温室に収容し、6日後の死虫数を調査し、試験例7と同様の計算式から死虫率を求めた。尚、試験は2区制でおこなった。その結果、以下の化合物が70%以上の死虫率を示した。

本発明化合物No. ; I-37, I-47, I-50, I-52, I-54, I-55, I-63, I-88, I-89, I-96, I-109, I-113, I-119, I-125, I-129, I-137, I-203, I-208, I-220, I-257, I-258, I-270, I-275, I-276, I-277, I-279, I-281

〔試験例10〕 ナミハダニに対する殺ダニ効力試験

インゲンの葉をリーフパンチを用いて径3.0cmの円形に切り取り、径7cmのスチロールカップ上の湿った滤紙上に置いた。これにナミハダニ幼虫を1葉当たり10頭接種した。明細書に記載された本発明化合物の5%乳剤（化合物によっては25%水和剤を供試）を展着剤の入った水で希釈して、500 ppm濃度の薬液に調整しこの薬液をスチロールカップ当たり2mlずつ回転式散布塔を用いて散布し、25℃の恒温室に収容し、96時間経過後の死虫率を試験例7と

同様の計算式から求めた。尚、試験は2区制で行なった。その結果、以下の化合物が70%以上の死虫率を示した。

本発明化合物No. ; I-37, I-45, I-47, I-50, I-52, I-54, I-55, I-64, I-95, I-105, I-109, I-111, I-113, I-115, I-117, I-125, I-126, I-127, I-128, I-129, I-131, I-133, I-137, I-139, I-161, I-162, I-164, I-165, I-166, I-167, I-168, I-169, I-289, I-290, I-294

〔試験例11〕ハスモンヨトウに対する殺虫効力試験

本発明化合物の10%乳剤（化合物によっては25%水和剤を供試）を展着剤の入った水で希釈して、500ppm濃度の薬液を調製した。この薬液中にカンランの葉を約10秒間浸漬し、風乾後シャーレに入れ、この中にハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*) の2齢幼虫をシャーレ当たり10頭放虫し、孔の開いた蓋をして25℃恒温室に収容した。6日後の死虫数を試験例7と同様の計算式から求めた。尚、試験は2区制で行なった。その結果、以下の化合物が70%の死虫率を示した。

本発明化合物No. ; I-270, I-275, I-276

〔試験例12〕モモアカアブラムシに対する殺虫効力試験

内径3cmのガラスシャーレに湿った漉紙を敷き、その上に同径のキャベツの葉を置いた。モモアカアブラムシ無翅雌成虫を4頭放ち、1日後に回転式散布塔にて薬液を散布（2.5mg/cm²）した。薬液は、明細書に記載された本発明化合物の5%乳剤（化合物によっては25%水和剤を供試）を展着剤の入った水で希釈して500ppm濃度に調整したものを用いた。処理6日後に成虫および幼虫の死虫率を試験例7と同様の計算式から求めた。なお試験は2区制で行なった。その結果、以下の化合物が70%の死虫率を示した。

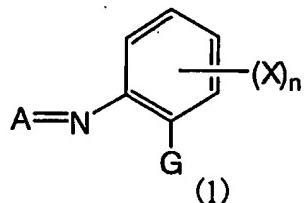
本発明化合物No. ; I-16, I-88, I-96, I-223, I-253, I-256, I-257, I-258, I-269, I-270, I-273, I-275, I-276, I-293

産業上の利用可能性

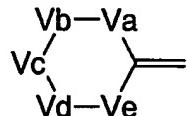
本発明のヘテロ環イミノフェニル化合物は優れた殺菌殺虫活性を有し、作物に対しても安全である。

請求の範囲

1. 式(1) :



〔式中、Aは、



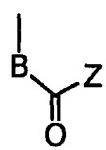
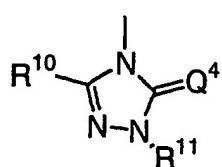
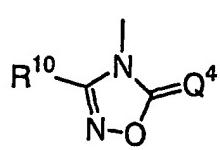
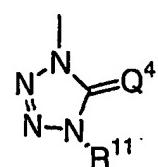
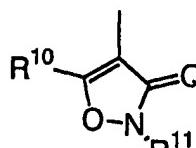
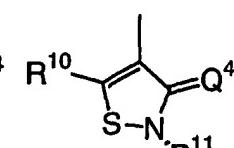
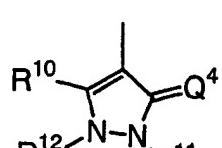
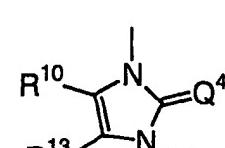
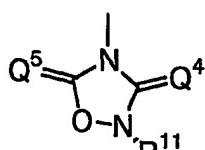
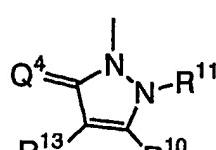
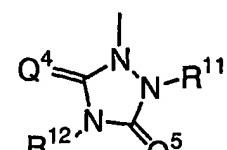
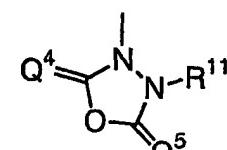
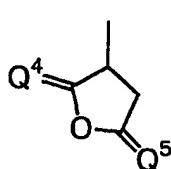
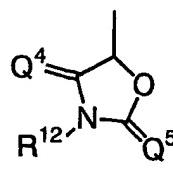
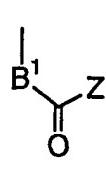
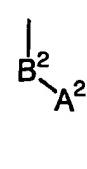
であり、V_a、V_b、V_cおよびV_dはそれぞれ独立に炭素原子、窒素原子、酸素原子または硫黄原子であり、V_eは炭素原子、窒素原子、酸素原子、硫黄原子または単結合であり（但し、V_a、V_b、V_c、V_dおよびV_eから選ばれる少なくとも1個は、窒素原子、酸素原子または硫黄原子である。）。

V_a—V_b、V_b—V_c、V_c—V_d、V_d—V_eの結合は、それぞれ単結合でも2重結合でもよく、

それぞれの原子上に水素原子またはYが結合していてもよく、

ただし、Aがキノロン環を表すときはキノロン環内の窒素原子は、イミノ結合のα位にあり、イミノ結合がピリミジン環、チアゾリン環またはチアゾリジン環の2位にあるときは、ピリミジン環の一方の窒素原子、チアゾリン環またはチアゾリジン環の窒素原子は置換基Yで置換されており、

Gは、G'からG¹⁶

 $\text{G}^1:$  $\text{G}^2:$  $\text{G}^3:$  $\text{G}^4:$  $\text{G}^5:$  $\text{G}^6:$  $\text{G}^7:$  $\text{G}^8:$  $\text{G}^9:$  $\text{G}^{10}:$  $\text{G}^{11}:$  $\text{G}^{12}:$  $\text{G}^{13}:$  $\text{G}^{14}:$  $\text{G}^{15}:$  $\text{G}^{16}:$

から選ばれる基を表し、

Z は、 $-\text{O}-\text{R}^1$ 、 $-\text{S}-\text{R}^1$ または $-\text{N}-\text{R}^2-\text{R}^3$ であり、

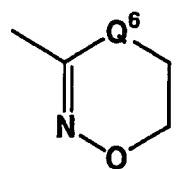
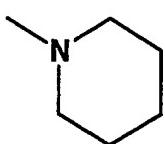
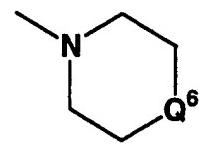
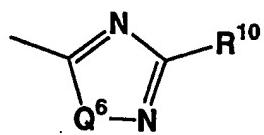
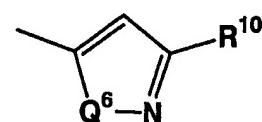
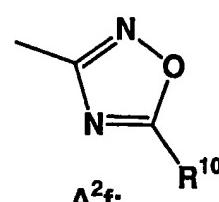
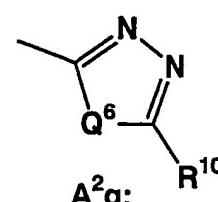
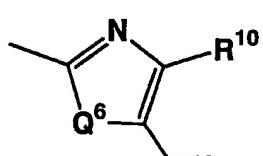
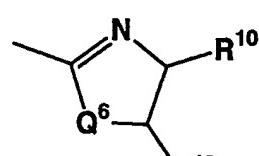
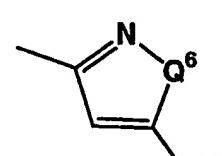
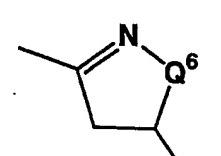
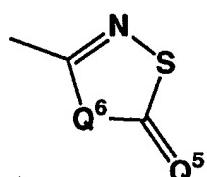
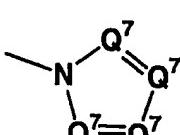
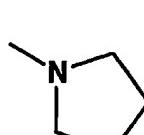
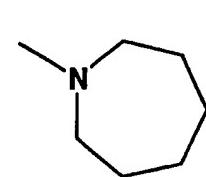
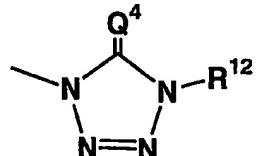
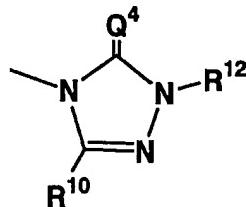
B は、 $-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{C}(=\text{CH}-\text{O}-\text{R}^4)-$ または $-\text{C}(=\text{N}-\text{O}-\text{R}^4)-$ であります。

B' は、 $-\text{N}(\text{O}-\text{R}^4)-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^5)-$ 、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{N}(\text{O}-\text{R}^4)-\text{C}-\text{H}_2-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^5)-\text{C}-\text{H}_2-$ 、 $-\text{O}-\text{C}-\text{H}_2-$ 、 $-\text{S}-\text{C}-\text{H}_2-$ 、 $-\text{N}(\text{O}-\text{R}^4)-\text{C}(=\text{CH}-\text{O}-\text{R}^4)-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^5)-\text{C}(=\text{CH}-\text{O}-\text{R}^4)-$ 、 $-\text{O}-\text{C}(=\text{C}-$

H - OR' -、 - S - C (= CH - OR') -、 - N (OR') - C (= N - OR') -、 - N (R') - C (= N - OR') -、 - O - C (= N - OR') - または - S - C (= N - OR') - であり、

B'は、 - CH,-、 - CH (CN) -、 - CH (C≡CH) -、 - C (= CH - OR') -、 - C (= N - OR') -、 - CH (OR') -、 - N (OR') -、 - N (R') -、 - O -、 - S -、 - N (OR') - CH,-、 - N (R') - CH,-、 - O - CH,- または - S - CH,- であり、

A'は、 R'で置換されていてもよいフェニル、 R'で置換されていてもよいピリジルまたは A'a から A'q

A²a:A²b:A²c:A²d:A²e:A²f:A²g:A²h:A²i:A²j:A²k:A²l:A²m:A²n:A²o:A²p:A²q:

から選ばれる基を表し、

Yは、Y' - D - (CH₂)_n-であるか（ただし、Yが2個以上の時は、同一または異なってもよい。）、Aの同一炭素原子上に置換した2個のYにより、該炭素原子とともに酸素原子、窒素原子または硫黄原子を各々1～3個含んでいて

もよい 3～7 員環または C=Q¹を形成するか、あるいは V_aと V_b、 V_bと V_c、 V_cと V_dまたは V_dと V_e上の 2 個の置換基 Y どうしが一緒にになって、 V_aと V_b、 V_bと V_c、 V_cと V_dまたは V_dと V_eとともに炭素原子、 窒素原子、 酸素原子および硫黄原子から選ばれる同一または相異なった 1 種以上の原子を含み、 Y で置換されていてもよい 5 または 6 員環を形成しており、

D は、 単結合、 -N R⁵-、 -C (=Q¹) -、 -C (=Q¹) -C (=Q¹) -、 -C R⁶=N -、 -N=C R⁶-、 -C R⁶=N-N=C R⁶-、 -N=C R⁶-O- N=C R⁶-、 -C R⁶=N-O-、 -C R⁶=N-O-C R⁶=N-O-、 -O-N =C R⁶-C R⁶=N-O-、 -C R⁶=N-N R⁵-または-O-N=C R⁶-C R⁶=N-N R⁵-であり、

Q¹、 Q²および Q³は、 各々独立に、 =O、 =S、 =N-R' または =C (R⁸) (R⁹) であり、

Q⁴および Q⁵は、 各々独立に =O または =S であり、

Q⁶は、 -S- または -O- であり、

Q⁷は、 各々独立に、 =N- または =CH- であり、

X は、 ハロゲン、 C₁～C₆アルキル、 C₁～C₆ハロアルキル、 C₁～C₆アルコキシ、 C₁～C₆ハロアルコキシ、 C₁～C₆アルキルチオ、 C₁～C₆アルキルアミノ、 (C₁～C₆アルキル) ₂アミノ、 NO₂、 CN、 ホルミル、 OH、 SH、 NU'U'、 C₁～C₆アルコキシカルボニル、 C₁～C₆アルキルカルボニル、 C₁～C₆ハロアルキルカルボニル、 R' で置換されていてもよいフェニルカルボニルまたは C₁～C₆アルキルカルボニルオキシであり（ただし、 置換する X が、 2 個以上の場合は同一か相互に異なってもよい。）、

R¹、 R²および R³は、 各々独立に、 水素原子、 C₁～C₆アルキル、 C₁～C₆ハロアルキル、 C₁～C₆シクロアルキル、 C₁～C₆アルコキシ C₁～C₆アルキル、 C₁～C₆アルキルスルフェニル C₁～C₆アルキル、 R' で置換されていてもよいフェニル C₁～C₆アルキルまたは R' で置換されていてもよいヘテロアリール C₁～C₆アルキルであり、

R⁴は、 水素原子、 C₁～C₆アルキル、 C₁～C₆ハロアルキル、 C₁～C₆シクロアルキル、 C₁～C₆アルコキシ C₁～C₆アルキル、 C₁～C₆アルキルスルフェニル C₁

～C₆アルキル、R'で置換されていてもよいフェニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルまたはR'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルキルであり、

R'およびR''は、各々独立に、ハロゲン、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆シクロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルキルスルフェニルC₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルコキシ、C₁～C₆アルキルスルフェニル、C₁～C₆アルキルスルフィニル、C₁～C₆アルキルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキルスルフェニル、C₁～C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₆ハロアルケニル、C₁～C₆ハロアルケニル、C₁～C₆アルケニルオキシ、C₁～C₆ハロアルケニルオキシ、C₁～C₆アルケニルスルフェニル、C₁～C₆アルケニルスルフィニル、C₁～C₆アルケニルスルホニル、C₁～C₆ハロアルケニルスルフェニル、C₁～C₆ハロアルケニルスルフィニル、C₁～C₆ハロアルキニル、C₁～C₆ハロアルキニル、C₁～C₆アルキニルオキシ、C₁～C₆ハロアルキニルオキシ、C₁～C₆アルキニルスルフェニル、C₁～C₆アルキニルスルフィニル、C₁～C₆アルキニルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキニルスルフェニル、C₁～C₆ハロアルキニルスルフィニル、N O₂、CN、ホルミル、OH、SH、SCN、C₁～C₆アルコキシカルボニル、C₁～C₆ハロアルコキシカルボニル、C₁～C₆アルキルカルボニル、C₁～C₆ハロアルキルカルボニル、C₁～C₆アルキルカルボニルオキシ、R'で置換されていてもよいフェニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキル、R'で置換されていてもよいフェニルスルホニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリール、R'で置換されていてもよいヘテロアリールスルホニル、R'で置換されていてもよいフェニルカルボニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニルまたは-N U¹U²であり、

但し、R'は水素原子であってもよく、

R'は、水素原子、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆シクロア

ルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルキルスルフェニルC₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルキルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキルスルホニル、C₁～C₆アルキルカルボニル、C₁～C₆ハロアルキルカルボニル、R'で置換されていてもよいフェニル、R'で置換されていてもよいフェノキシ、R'で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルコキシ、R'で置換されていてもよいフェニルスルホニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルスルホニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリール、R'で置換されていてもよいヘテロアリールオキシ、R'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルキル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニル、R'で置換されていてもよいフェノキシカルボニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルカルボニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールオキシカルボニルまたはR'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルキルカルボニルであり、

R'およびR''は、各々独立に、水素原子、ハロゲン、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆アルキルスルフェニル、C₁～C₆アルケニル、N O₂、C N、ホルミルまたはC₁～C₆アルコキシカルボニルであり、

R'''は、水素原子、ハロゲン、R''¹⁴、-OR''¹⁴、-SR''¹⁴、-SOR''¹⁴、または-SO₂R''¹⁴であり、

R''¹⁴は、水素原子、R''またはCNであり、

R''¹⁴は、水素原子またはR''¹⁴であり、

R''¹⁴は、水素原子、ハロゲン、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆シクロアルキル、C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルケニルまたはC₁～C₆アルキニルであり、

R''¹⁴は、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆アルケニル、C₁～C₆ハロアルケニル、C₁～C₆アルキニル、C₁～C₆ハロアルキニル、C₁～C₆シクロアルキル、C₁～C₆アルキルカルボニルまたはC₁～C₆アルコキシカルボニルであり、

Y' は、ハロゲン、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルキル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆シクロアルキル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルケニル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルキニル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルコキシ、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルコキシ、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルケニルオキシ、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルキニルオキシ、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルキルスルフェニル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルケニルスルフェニル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルキルスルフィニル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルキニルスルフィニル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルキルスルホニル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルキニルスルホニル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルコキカルボニル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₆アルキルカルボニルオキシ、R^bで置換されていてもよいフェニル、R^bで置換されていてもよいフェノキシ、R^bで置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキル、R^bで置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルコキシ、R^bで置換されていてもよいフェニルスルホニル、R^bで置換されていてもよいフェニルスルフィニル、R^bで置換されていてもよいフェニルスルフェニル、R^bで置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルスルフィニル、R^bで置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルスルホニル、R^bで置換されていてもよいヘテロアリール、R^bで置換されていてもよいヘテロアリールオキシ、R^bで置換されていてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルキル、R^bで置換されていてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルコキシ、R^bで置換されていてもよいヘテロアリールスルフィニル、R^bで置換されていてもよいヘテロアリールスルホニル、R^bで置換されていてもよいヘテロアリールスルフェニル、R^bで置換されていてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルキルスルフェニル、R^bで置換されていてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルキルスルフィニル、R^bで置換されていてもよいヘテロア

リールC₁～C₆アルキルスルホニル、R'で置換されていてもよいフェニルカルボニル、R'で置換されていてもよいフェニルカルボニルオキシ、R'で置換されていてもよいフェノキシカルボニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルカルボニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルカルボニルオキシ、R'で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニルオキシ、R'で置換されていてもよいヘテロアリールオキシカルボニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルキルカルボニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルキルカルボニルオキシ、NO₂、CN、ホルミルまたはナフチルであり、

R'は、ハロゲン、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆シクロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルキルスルフェニルC₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルコキシ、C₁～C₆アルキルスルフェニル、C₁～C₆アルキルスルフィニル、C₁～C₆アルキルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキルスルフェニル、C₁～C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₆ハロアルケニル、C₁～C₆ハロアルケニル、C₁～C₆アルケニルオキシ、C₁～C₆ハロアルケニルオキシ、C₁～C₆アルケニルスルフェニル、C₁～C₆アルケニルスルフィニル、C₁～C₆アルケニルスルホニル、C₁～C₆ハロアルケニルスルフェニル、C₁～C₆ハロアルケニルスルフィニル、C₁～C₆ハロアルケニルスルホニル、C₁～C₆アルキニル、C₁～C₆ハロアルキニル、C₁～C₆アルキニルオキシ、C₁～C₆ハロアルキニルオキシ、C₁～C₆アルキニルスルフェニル、C₁～C₆アルキニルスルフィニル、C₁～C₆アルキニルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキニルスルフェニル、C₁～C₆ハロアルキニルスルフィニル、C₁～C₆ハロアルキニルスルホニル、NO₂、CN、ホルミル、SH、OH、SCN、C₁～C₆アルコキシカルボニル、C₁～C₆アルキルカルボニル、C₁～C₆ハロアルキルカルボニル、C₁～C₆アルキルカルボニルオキシ、フェニルまたは-NU'U'であって、置換するR'の数は1ないし5個であり（ただし、R'が2個以上の場合には同一か相互に異なってもよい）、

R'は、ハロゲン、C₁～C₆シクロアルキル、C₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆アル

コキシC₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆アルキルスルフェニルC₁～C₆アルコキシ、C₁～C₆ハロアルコキシ、C₁～C₆アルキルスルフェニル、C₁～C₆アルキルスルフィニル、C₁～C₆アルキルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキルスルフェニル、C₁～C₆ハロアルキルスルフィニル、C₁～C₆ハロアルケニルオキシ、C₁～C₆ハロアルケニルオキシ、C₁～C₆アルケニルスルフェニル、C₁～C₆アルケニルスルフィニル、C₁～C₆アルケニルスルホニル、C₁～C₆ハロアルケニルスルフェニル、C₁～C₆ハロアルケニルスルフィニル、C₁～C₆ハロアルキニルオキシ、C₁～C₆ハロアルキニルオキシ、C₁～C₆アルキニルスルフェニル、C₁～C₆アルキニルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキニルカルボニル、C₁～C₆アルキルカルボニル、C₁～C₆ハロアルキルカルボニル、C₁～C₆アルキルカルボニルオキシ、R'で置換されていてもよいフェニル、R'で置換されていてもよいフェノキシ、R'で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルコキシ、R'で置換されていてもよいフェニルスルホニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルスルホニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリール、R'で置換されていてもよいヘテロアリールオキシ、R'で置換されていてもよいヘテロアリールスルホニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニルオキシカルボニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニルまたはR'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルキルカルボニルまたは-NU'U'であるか、あるいは、酸素原子、窒素原子または硫黄原子から選ばれた1から4個のヘテロ原子を含んでいてもよい3から7員環であって、置換するR'の数は1ないし8個であり（ただし、R'が2個以上の場合は同一か相互に異なってよい）、

R'は、ハロゲン、R'で置換されていてもよいC₁～C₆アルキル、R'で置換されていてもよいC₁～C₆シクロアルキル、R'で置換されていてもよいC₁～C₆ア

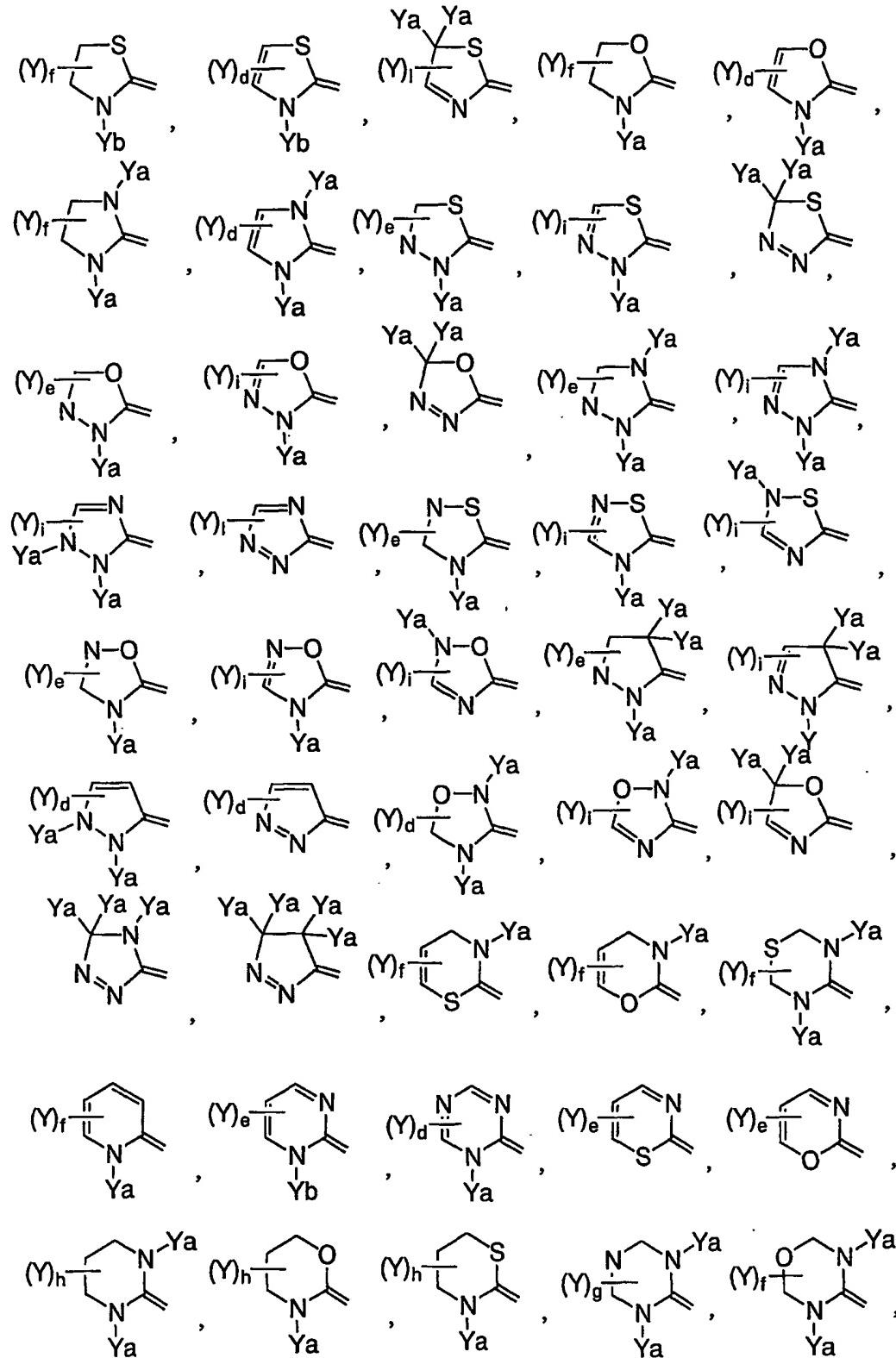
もよいヘテロアリールC₁～C₆アルキルスルホニル、R'で置換されていてもよいフェニルカルボニル、R'で置換されていてもよいフェニルカルボニルオキシ、R'で置換されていてもよいフェノキシカルボニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルカルボニル、R'で置換されていてもよいフェニルC₁～C₆アルキルカルボニルオキシ、R'で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールカルボニルオキシカルボニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルキルカルボニル、R'で置換されていてもよいヘテロアリールC₁～C₆アルキルカルボニルオキシまたは-N(U')_nU'であり、置換するR'の数は1ないし5個であり（ただし、R'が2個以上の場合は同一か相互に異なってもよい）。

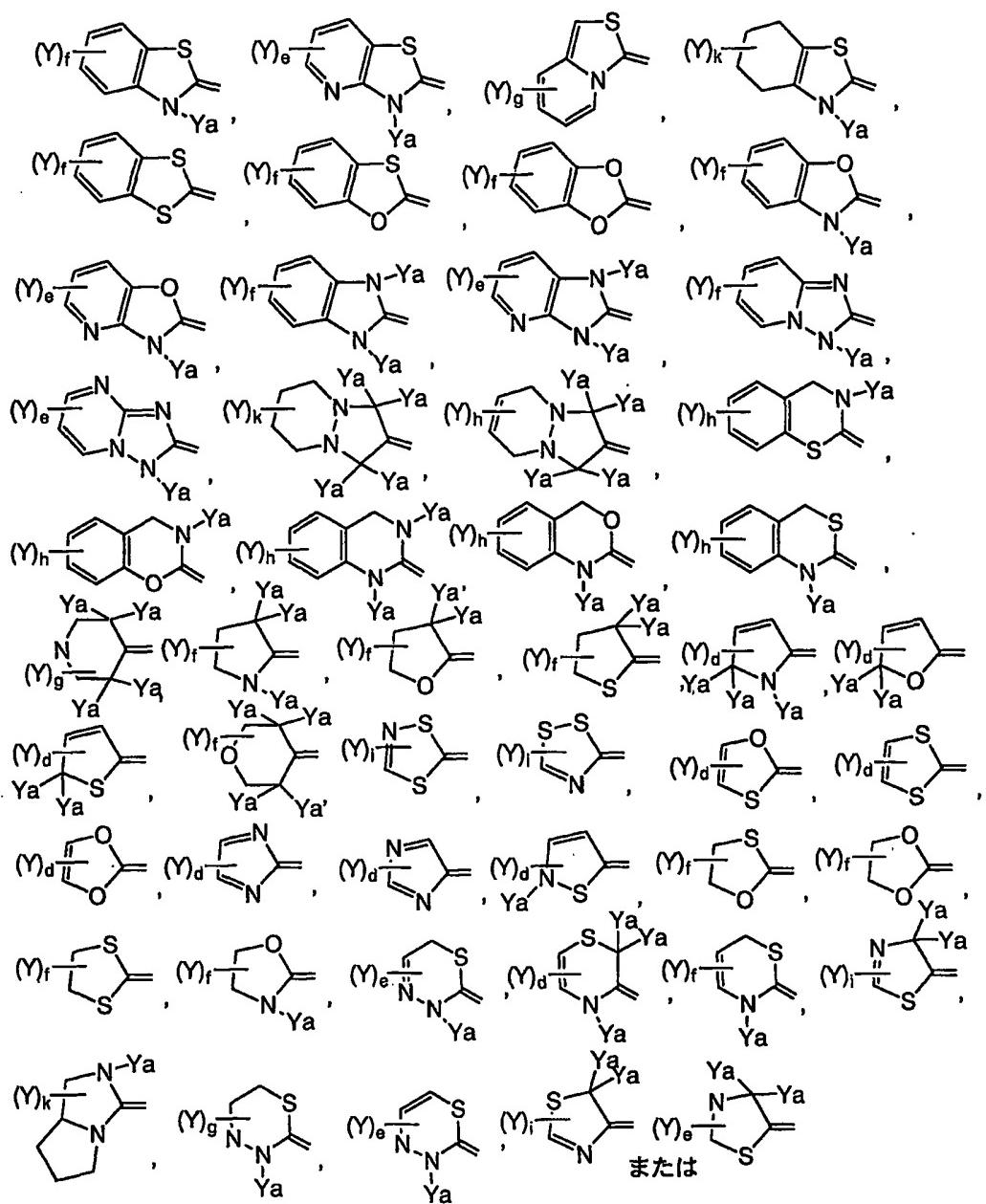
U'およびU'は、各々独立に、水素原子、C₁～C₆アルキル、C₁～C₆ハロアルキル、C₁～C₆シクロアルキル、C₁～C₆アルコキシC₁～C₆アルキル、C₁～C₆アルキルスルフェニルC₁～C₆アルキル、ホルミル、C₁～C₆アルキルスルホニル、C₁～C₆ハロアルキルスルホニル、C₁～C₆アルコキシカルボニル、C₁～C₆アルキルカルボニルまたはC₁～C₆ハロアルキルカルボニルであるか、あるいはU'およびU'が一緒になって酸素原子、窒素原子または硫黄原子から選ばれた1から4個のヘテロ原子を含んでいてもよい3から7員環であり、

nは、置換基の数を表し、0から4であり、

pは、繰り返しの数を表し、0から2である。]で表されるヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

2. Aが





であり、dは、置換基の数を表し、0から2であり、

eは、置換基の数を表し、0から3であり、

f は、置換基の数を表し、0から4であり、

g は、置換基の数を表し、0から5であり、

hは、置換基の数を表し、0から6であり、

iは、置換基の数を表し、0から1であり、

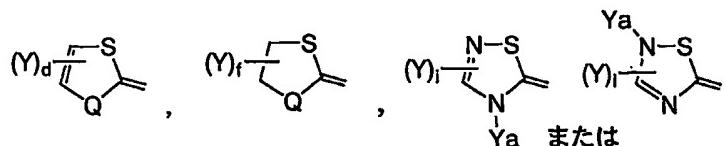
j は、置換基の数を表し、0から7であり、

k は、置換基の数を表し、0から8であり、

Y_a、Y_bおよびYは、互いに独立にY' - D - (CH₂)_p-であるか（ただし、YまたはY_aが2個以上の時は、Y_aどうしまたはYどうしは互いに同一または異なってもよい。）、Aの同一炭素原子上に置換した2個のYまたはY_aにより、該炭素原子とともに酸素原子、窒素原子または硫黄原子を各々1～3個含んでいてもよい3～7員環またはC=Q'を形成し、

Yは更に水素原子を表していてもよい、請求項1記載のヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

3. Aが



を表し、Qは酸素原子、硫黄原子またはN-Y_bを表し、Y、Y_a、Y_b、d、fおよびiは請求項2と同じ意味を表す、請求項1または請求項2記載のヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

4. Dが単結合であり、pが0である請求項1から請求項3のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

5. Y'がハロゲン、R^bで置換されていてもよいC₁～C₁₂アルキル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₁₂アルコキシ、R^bで置換されていてもよいC₁～C₁₂アルキルスルフェニル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₁₂アルキルスルフィニル、R^bで置換されていてもよいC₁～C₁₂アルキルスルホニル、R^bで置換されていてもよいフェニルまたはR^bで置換されていてもよいヘテロアリールである、請求項1から請求項4のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

6. GがG¹、G²、G¹⁵または-B¹-A¹aである請求項1から請求項5のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

7. Gが $-N(O R^4) - C(=O) Z$ または $-N(R^4) - C(=O) Z$ である請求項1から請求項5のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

8. Y'が少なくともひとつのR'で置換されたフェニルまたは少なくともひとつ以上のR'で置換されたヘテロアリールであり、R'のうち少なくともひとつがトリフルオロメチルであり、ただし、GがG'のときはnが1以上である、請求項1から請求項7のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物またはその農薬として許容される塩。

9. 農薬として許容される塩が塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩、ギ酸塩、酢酸塩またはシウ酸塩である、請求項1から請求項8のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物の塩。

10. 請求項1から請求項9のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物およびその農薬として許容される塩から選ばれる一種以上を有効成分として含有する農薬。

11. 請求項1から請求項9のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物およびその農薬として許容される塩から選ばれる一種以上を有効成分として含有する殺菌剤。

12. 請求項1から請求項9のいずれかに記載のヘテロ環イミノフェニル化合物およびその農薬として許容される塩から選ばれる一種以上を有効成分として含有する殺虫剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/06424

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl⁷ C07D213/74, 239/42, 271/10, 277/42, 82, 279/06, 285/16, 12, 339/06, 327/04, 411/04, 10, 14, 413/04, 417/04, 10, 12, A01N43/28, 30, 40, 50, 52, 54, 56, 64, 653, 76, 78, 82, 824, 836, 86, 88, 90

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl⁷ C07D, A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

REGISTRY (STN), CAPLUS (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	US 5238903 A (FUJI PHOTO FILM CO., LTD.), 24 August, 1993 (24.08.93), Full text; particularly, compounds on columns 15 to 36 & JP 3-244593 A	1, 2, 4-7
X	US 5021394 A (DAI NIPPON PRINTING CO., LTD.), 04 June, 1991 (04.06.91), Particularly, compounds 14, 18 on columns 5 to 6 & JP 3-16792 A	1, 2, 4-7
X	EP 287377 A2 (SUMITOMO CHEMICAL CO., LTD.), 19 October, 1988 (19.10.88), Particularly, compound 64 on page 27 & JP 1-165565 A & US 5028708 A & US 5061796 A & US 5136054 A & US 5220027 A	1, 2, 4-7

Further documents are listed in the continuation of Box C. See patent family annex.

* Special categories of cited documents:	
"A"	document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
"E"	earlier document but published on or after the international filing date
"L"	document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
"O"	document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
"P"	document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed
"T"	later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"X"	document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"Y"	document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"&"	document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search 25 July, 2002 (25.07.02)	Date of mailing of the international search report 06 August, 2002 (06.08.02)
---	--

Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/06424

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	JP 5-177959 A2 (FUJI PHOTO FILM CO., LTD.), 20 July, 1993 (20.07.93), Particularly, compound 23 on page 23; compound 35 on page 26; pigment e on page 48 (Family: none)	1-8
X	JP 5-70704 A (FUJI PHOTO FILM CO., LTD.), 23 March, 1993 (23.03.93), Particularly, compound 3-6 on page 12; compounds 15, 16 on page 14; compounds 19, 20, 23 on page 15; compound 26 on page 16; compound 48 on page 20; compounds 53, 54 on page 22 (Family: none)	1-8
X	JP 5-202305 A (FUJI PHOTO FILM CO., LTD.), 10 August, 1993 (10.08.93), Particularly, compound 17 on page 17 (Family: none)	1,2,4-8
X	KALCHEVA, V., et al., Ring transformations of oxazoles and their derivatives. Synthesis of 2, 3-dihydro-2-[(2-hydroxyphenyl)imino]-4- methylthiazoles by reaction of 2-[(2-oxopropyl)thio] benzoxazoles with amines. Liebigs Ann. Chem., 1993, No.12, pages 1319 to 1322; refer to 2'- phenylcarbamoyloxy derivative 4d on page 1322	1-7
X	GB 2226562 A1 (BOOTS CO. PLC), 04 July, 1990 (04.07.90), Particularly, 4-[2-(1, 3, 3-trimethyl-2- pyrrolidinylideneamino)-benzyl] morpholine on page 17; 4-[2-(1, 3-dimethyl-2-pyrrolidinylideneamino)- benzyl] morpholine on page 24; 4-[4-chloro-2-(1, 3-dimethyl-2- pyrrolidinylideneamino)-benzyl] morpholine on page 24 & EP 385038 A1 & US 5223498 A & JP 02229148 A & US 5373008 A	1,2,4,5
P,X	WO 01/47888 A1 (NISSAN CHEMICAL INDUSTRIES), 05 July, 2001 (05.07.01), Full text (Family: none)	1-12

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/06424

<Concerning the subject of search>

In the general formula set forth in claim 1, most of the constituent moieties are represented in terms of replaceable groups, and the general formula therefore includes extremely many compounds. However, only a special part of the claimed compounds are supported by the description within the meaning of PCT Article 6 and disclosed within the meaning of PCT Article 5.

Accordingly, this prior art search has been made only on the disclosed compounds, i.e., compounds represented by the general formula wherein A is a group described in claim 2, Y' dose not form any additional fused ring, and G is G1, G2, G15, or G16, with the proviso that when G is G16, B2 is -CH2- and A2 is a heterocycle.

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl. ' C07D213/74, 239/42, 271/10, 277/42, 82, 279/06, 285/16, 12, 339/06, 327/04, 411/04, 10, 14, 413/04, 417/04, 10, 12, A01N43/28, 30, 40, 50, 52, 54, 56, 64, 653, 76, 78, 82, 824, 836, 86, 88, 90

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl. ' C07D, A01N

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

REGISTRY (STN), CAPLUS (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	US 5238903 A (FUJI PHOTO FILM CO., LTD.) 1993. 08. 24 全文献、特に、第15欄～36欄の化合物などを参照。 & JP 3-244593 A	1, 2, 4-7
X	US 5021394 A (DAI NIPPON PRINTING CO., LTD.) 1991. 06. 04 特に、第5-6欄の化合物No. 14, 18などを参照。 & JP 3-16792 A	1, 2, 4-7

 C欄の続きにも文献が列挙されている。 パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

25. 07. 02

国際調査報告の発送日

06.08.02

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

齋藤 恵

4 P

9164



電話番号 03-3581-1101 内線 3490

C(続き) 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	EP 287377 A2 (SUMITOMO CHEMICAL CO., LTD.) 1988.10.19 特に、第27頁の化合物No. 64などを参照。 & JP 1-165565 A & US 5028708 A & US 5061796 A & US 5136054 A & US 5220027 A	1, 2, 4-7
X	JP 5-177959 A2 (FUJI PHOTO FILM CO., LTD.) 1993.07.20 特に、第23頁の化合物23、第26頁の化合物35、第48の色素eなどを 参照。 (ファミリーなし)	1-8
X	JP 5-70704 A (FUJI PHOTO FILM CO., LTD.) 1993.03.23 特に、第12頁の化合物3-6、第14頁の化合物15, 16、第15頁の化合物 19, 20, 23、第16頁の化合物26、第20頁の化合物48、第22頁の化合物 53, 54などを参照。 (ファミリーなし)	1-8
X	JP 5-202305 A (FUJI PHOTO FILM CO., LTD.) 1993.08.10 特に、第17頁の化合物17などを参照。 (ファミリーなし)	1, 2, 4-8
X	KALCHEVA, V., et al. Ring transformations of oxazoles and their derivatives. Synt thesis of 2, 3-dihydro-2-[(2-hydroxyphenyl) imino]-4- methylthiazoles by reaction of 2-[(2-oxopropyl) thio] benzoxazoles with amines. Liebigs Ann. Chem., 1993, No. 12, p. 1319-1322. p. 1322に記載された4dの2'-phenylcarbamoyloxy誘導体を参照。	1-7
X	GB 2226562 A1 (BOOTS, CO. PLC) 1990.07.04 特に、第17頁に記載の 4-[2-(1, 3, 3-trimethyl-2-pyrrolidinylideneamino)-benzyl] morpholine, 第24頁に記載の 4-[2-(1, 3-dimethyl-2-pyrrolidinylideneamino)-benzyl] morpholine, 4-[4-chloro-2-(1, 3-dimethyl-2-pyrrolidinylideneamino)- benzyl]morpholine などを参照。 & EP 385038 A1 & US 5223498 A & JP 02229148 A & US 5373008 A	1, 2, 4, 5
PX	WO 01/47888 A1 (NISSAN CHMICAL INDUSTRIES) 2001.07.05 全文献を参照。 (ファミリーなし)	1-12

<調査の対象について>

請求の範囲1に記載された化合物の一般式は、大部分が可変の基で表現され、非常に多数の化合物を含むものである。しかしながら、PCT第6条の意味において明細書に裏付けられ、また、PCT第5条の意味において開示されているのは、請求の範囲に記載された化合物の特定の部分に限られている。

したがって、先行技術文献調査は、開示されている部分、すなわち、請求の範囲に記載の一般式における基Aが請求の範囲2に記載されているものであって、Y'がさらなる縮合環を形成せず、かつ、基GがG1、G2、G15、又はG16であって、GがG16である場合には、B2は-CH2-であり、かつ、A2が複素環であるものに限定して行った。